苯并吡喃酮类化合物及其制备与应用

技术领域

本发明属农用杀虫、杀菌剂,具体地说是一种苯并吡喃酮类化合物及其制备与应用。

背景技术

天然产物苯并吡喃酮和甲氧基丙烯酸酯化合物均是已知的具有生物活性的化合物。文献 JP04-182461 曾公开了如下通式的化合物:

10

该专利中公开的化合物 51 的结构化学如下:

文献中没有公开该化合物的活性数据。然而通过合成并进行生测,发现该化合物活性较低。

15

发明内容

本发明的目的在于提供一种在很小的剂量下就可以控制各种病虫害的苯并吡喃酮类 化合物,它可应用于农业上以防治作物的病害和虫害。

本发明的技术方案如下:

本发明提供一种苯并吡喃酮类化合物,如通式(I)所示:

式中:

A选自CH或N;

B 选自 O、S 或 NR₉, R₉ 选自氢或 C₁—C₁₂ 烷基;

 R_1 、 R_2 分别选自氢、 C_1 — C_{12} 烷基或卤代 C_1 — C_{12} 烷基;

 R_3 选自氢、 C_1 — C_{12} 烷基、卤代 C_1 — C_{12} 烷基或 C_1 — C_{12} 烷氧基;

R₄、R₅、R₆、R₇、R₈可相同或不同,分别选自氢、卤素、氰基、硝基、C₁—C₁₂ 烷基、C₂—C₁₂ 烯基、C₂—C₁₂ 炔基、C₁—C₁₂ 卤代烷基、C₁—C₁₂ 烷氧基、C₁—C₁₂ 烷硫基、C₁—C₁₂ 烷硫基、C₁—C₁₂ 烷磺基基基、C₁—C₁₂ 烷氧基羰基、C₁—C₁₂ 烷氧基羰基、C₁—C₁₂ 烷氧基羰基、C₁—C₁₂ 烷氧基羰基 C₁—C₁₂ 烷基或含有 0-2 个 C₁—C₁₂ 烷基取代的胺基 C₁—C₁₂ 烷基,含有 0-3 个取代基的芳基、芳氧基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、杂芳基、杂芳基 C₁—C₁₂ 烷基或杂芳基 C₁—C₁₂ 烷基或杂芳基 C₁—C₁₂ 烷氧基,其所述 0-3 个取代基选自卤素、硝基、C₁—C₆ 烷基、C₁—C₆ 烷基、C₁—C₆ 烷基或异子的基团:

其中: R_{10} 、 R_{11} 分别选自氢、 C_1 - C_{12} 烷基、芳基或芳基 C_1 - C_{12} 烷基: 当 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 均为氢时,B 不为 NR_9 :

15 及其立体异构体。

25

30

本发明中较为优选的化合物为: 通式(I)中

A选自CH或N:

B 选自 O、S 或 NR₉, R₉选自氢或 C₁—C₆烷基;

 R_1 、 R_2 分别选自氢、 C_1 — C_6 烷基或卤代 C_1 — C_6 烷基;

20 R₃ 选自氢、C₁—C₆烷基、卤代 C₁—C₆烷基或 C₁—C₆烷氧基;

其中: R₁₀、R₁₁分别选自氢、C₁—C₁₂烷基、芳基或芳基 C₁—C₆烷基: 当 R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈均为氢时, B 不为 NR₉。

本发明中进一步优选的化合物为:通式(I)中A选自CH或N:

B选自O或NH;

R₁、R₂分别选自甲基;

R3 选自氢或甲基;

其中: R_{10} 、 R_{11} 分别选自氢或 C_1 — C_6 烷基: 当 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 均为氢时, B 不为 NH。

本发明中更进一步优选的化合物为: 通式(I)中

A 选自 CH 或 N;

. 10

15

20

25

B选自O或NH:

R₁、R₂选自甲基;

R₃ 选自氢或甲基:

 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 可相同或不同,分别选自氢、氯、溴、氟、氰基、 C_1 — C_6 烷基、 C_1 — C_6 卤代烷基、 C_1 — C_6 烷基羰基、 C_1 — C_6 烷氧基 C_1 — C_3 烷基、 C_1 — C_3 烷基 C_1 — C_2 烷 C_1 — C_2 烷 C_1 — C_2 烷 C_1 — C_2 C_1 — $C_$

其中 R_{10} 、 R_{11} 为甲基; 当 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 均为氢时,B 不为 NH。以上给出的通式(I)化合物的定义中,汇集所用术语一般代表如下取代基: 卤: 指氟、氯、溴或碘。

烷基:直链或支链烷基,例如甲基、乙基、丙基、异丙基或叔丁基。

' 卤代烷基: 直链或支链烷基,在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代,例如,卤代烷基诸如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基。

烷氧基: 直链或支链烷基, 经氧原子键连接到结构上。

卤代烷氧基: 直链或支链烷氧基,在这些烷氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。例如,卤代烷氧基诸如氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧

基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、三氟乙氧基。

链烯基:直链或支链并可在任何位置上存在有双键,例如乙烯基、烯丙基。取代链烯基包括任意取代的芳基链烯基。

炔基:直链或支链并可在任何位置上存在有三键,例如乙炔基、炔丙基。取代炔基包括任意取代的芳炔基。

芳基以及芳烷基、芳基链烯基、芳炔基、芳氧基和芳氧基烷基中的芳基部分包括苯基 和萘基。

苯基、苯氧基、苄基、苄氧基中可以含有的取代基为氢、烷基、烷氧基、卤代烷基、 卤代烷氧基、卤素、硝基、氰基等,取代基的数目可为 1~5。

10 本发明中所指杂芳基是含 1 个或多个 N、O、S 杂原子的 5 元环或 6 元环。例如呋喃、 噻酚、吡咯、吡唑、咪唑、噻唑、三唑、吡啶、嘧啶、吡嗪、哒嗪、三嗪、喹啉、苯并呋 喃。

在本发明的化合物中,由于碳-碳双键和碳-氮双键连接不同的取代基而可以形成几何 异构体(分别以 Z 和 E 来表示不同的构型)。本发明包括 Z 型异构体和 E 型异构体及其任 何比例的混合物。

可以用下面表 1 中列出的化合物来说明本发明,但并不限定本发明。

其中 R₁、R₂=CH₃; E 为 C(CH₃)=NOCH₃; M 为 C₆H₃-3,4-(OCH₃)₂

20 表 1

5

15

编号	A	В	R ₃	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	物性*
1	СН	0	Н	Н	Н	Н	Н	H	油状
2	СН	0	Н	Н	CH ₃	Н	Н	Н	140~143
3	СН	0	Н	Н	CH ₃	Н	·H	CH ₃	188-190
4	СН	0	Н	Н	C ₆ H ₅	Н	, H	CH ₃	146-148
. 5	СН	0	Н.	CH₃	CH₃	Н	Н	Н	120~122
6	СН	0	Н	CH ₃	CH₃	Н	Н	CH ₃	174~176
7	СН	· O .	Н	. н	CF ₃	Н	Н	. Н	164~166
. 8	СН	0	Н	Н	. CH ₃	Н	Н	E ·	油状
9	СН	0	Н	Н	CH ₃	Н	E	Н	183~185

10 CH O H H CH ₃ H COCH ₃ H 11 CH O H H CH ₃ H H COCH ₃ 12 CH O H CI CH ₃ H H H 13 CH O H H CH ₂ CI H H H 14 CH O H CI CH ₂ CI H H H 15 CH O H CI CH ₂ OCH ₃ H H H H 16 CH O H CI CH ₂ CH ₃ H H H H H H H H H H CH ₃ H H	169~172 165~167 162-164 154-156 132-135 140-142
12 CH O H CI CH ₃ H H H H 13 CH O H H CH ₂ CI H H H H 14 CH O H CI CH ₂ CI H H H H 15 CH O H CI CH ₂ OCH ₃ H H H H 16 CH O H CI CH ₂ CH ₃ H H H H H H H H H H CH ₃ H H H CH ₃ H H	162-164 154-156 132-135
13 CH O H H CH ₂ CI H H H H 14 CH O H CI CH ₂ CI H H H H 15 CH O H CI CH ₂ OCH ₃ H H H H H 16 CH O H CI CH ₂ CH ₃ H H H H H 17 CH O H H CH ₂ CH ₃ H H CH ₃ 18 CH O H CH ₂ CH ₅ CH ₃ H H H H 19 CH O H H CH ₂ OCH ₃ H H H H H 20 CH O H H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H H	154-156 132-135
14 CH O H CI CH ₂ CI H H H H 15 CH O H CI CH ₂ OCH ₃ H H H H 16 CH O H CI CH ₂ CH ₃ H H H H H 17 CH O H H CH ₂ CH ₃ H H CH ₃ 18 CH O H CH ₂ CH ₃ CH H H H 19 CH O H H CH ₂ OCH ₃ H H H H 20 CH O H H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H H	132-135
15 CH O H CI CH ₂ OCH ₃ H H H 16 CH O H CI CH ₂ CH ₃ H H H 17 CH O H H CH ₂ CH ₃ H H CH ₃ 18 CH O H C ₂ H ₅ CH ₃ H H H 19 CH O H H CH ₂ OCH ₃ H H H 20 CH O H H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H	132-135
16 CH O H CI CH ₂ CH ₃ H H H H 17 CH O H H CH ₂ CH ₃ H H CH ₃ 18 CH O H C ₂ H ₅ CH ₃ H H H 19 CH O H H CH ₂ OCH ₃ H H H 20 CH O H H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H	132-135
17 CH O H H CH ₂ CH ₃ H H CH ₃ 18 CH O H CH ₃ H H H H 19 CH O H H CH ₂ OCH ₃ H H H H 20 CH O H H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H	132-135
18 CH O H C ₂ H ₅ CH ₃ H H H 19 CH O H H CH ₂ OCH ₃ H H H 20 CH O H H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H	132-135
19 CH O H H CH2OCH3 H H H 20 CH O H H CH2OC2H5 H H	
20 CH O H H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H	140-142
21 CH O H CI CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H	
22 CH O H OCH ₃ CH ₂ OCH ₃ H H H	-
23 CH O H N(CH ₃) ₂ CH ₃ H H H	
24 CH O H CN H H H H	166-168
25 CH O H Cl CH ₃ H H CH ₃	202-204
26 CH O H H CH(CH ₃) ₂ H H H	128-130
27 CH O H C ₃ H ₇ CH ₃ H H H	142-144
28 CH O H H t C ₄ - H ₉ H H H	
29 CH O H H 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H	149-152
30 CH O H CI 4-CI-C ₆ H ₄ H H H	
31 CH O H H 4-CI-C ₆ H ₄ H H CH ₃	
32 CH O H Cl C ₆ H ₅ H H H	142-144
33 CH O H H CH ₂ CH ₃ H H H	134-136
34 CH O H H CH ₂ C ₂ H ₅ H H H	118-120
35 · CH O H H CH ₂ C ₂ H ₅ H H CH ₃	146-148
36 CH O H Cl CH ₂ C ₂ H ₅ H H H	118-120
37 CH O H CH ₃ CH ₂ C ₂ H ₅ H H H	112-115
38 CH O H H 4-F-C ₆ H ₄ H H H	132-134
39 CH O H CI 4-F-C ₆ H ₄ H H H	
40 CH O H · H 4-F-C ₆ H ₄ H H CH ₃	•
41 CH O H H 4-CF ₃ -C ₆ H ₄ H H H	161-162
42 CH O H CI 4-CF ₃ -C ₆ H ₄ H H H	
43 CH O H CI CH ₂ N(CH ₃) ₂ H H H	

5

44 CH O H OCH3 C2H5 H	163-164 130-133
46 CH O H OC ₂ H ₅ CH ₃ H H	130-133
47 CH O H H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H	130-133
48 CH O H CI CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 49 CH O H F CF ₃ H H H H 50 CH O H F CH ₃ H H <t< td=""><td>130-133</td></t<>	130-133
49 CH O H F CF3 H H H 50 CH O H F CH3 H H H 51 CH O H H CH2N(CH3)2 H H H 52 CH O H H CGH5 H H H 53 CH O H CI CI H H H 54 CH O H F CI H H H 55 CH O H H CH2OCH2C6H5 H E H 56 CH O H OCH3 4-CI-C6H4 H H H H 57 CH O H F 4-CI-C6H4 H H H H	130-133
50 CH O H F CH ₃ H H H H 51 CH O H H CH ₂ N(CH ₃) ₂ H H H H 52 CH O H H CGH ₅ H H H H 53 CH O H CI CI H H H H 54 CH O H F CI H H H H 55 CH O H H CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅ H E H 56 CH O H OCH ₃ 4-CI-C ₆ H ₄ H H H H 57 CH O H F 4-CI-C ₆ H ₄ H H H H	130-133
50 CH O H F CH ₃ H H H H 51 CH O H H CH ₂ N(CH ₃) ₂ H H H H 52 CH O H H CGH ₅ H H H H 53 CH O H CI CI H H H H 54 CH O H F CI H	130-133
52 CH O H H C ₆ H ₅ H H H H 53 CH O H Cl Cl H H H H 54 CH O H F Cl H H H H 55 CH O H H CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅ H E H 56 CH O H OCH ₃ 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H H 57 CH O H F 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H H	
53 CH O H CI CI H H H H 54 CH O H F CI H H H 55 CH O H H CH2OCH2C6H5 H E H 56 CH O H OCH3 4-CI-C6H4 H H H 57 CH O H F 4-CI-C6H4 H H H	
54 CH O H F CI H H H 55 CH O H H CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₅ H E H 56 CH O H OCH ₃ 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H 57 CH O H F 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H	81-83
55 CH O H H CH2OCH2C6H5 H E H 56 CH O H OCH3 4-Cl-C6H4 H H H 57 CH O H F 4-Cl-C6H4 H H H	81-83
56 CH O H OCH3 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H 57 CH O H F 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H	81-83
57 CH O H F 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H	81-83
	81-83
58 CH O H H M H H	81-83
	٠. ت
59 CH O H CI M H H H	
60 CH O H CI M H H CH ₃	
61 CH O H CH ₃ S CH ₃ H H H	
62 CH O H CH ₃ SO ₂ CH ₃ H H H	
63 CH O H F F H H H	
64 CH O H CH ₃ SO ₂ Cl H H H	
65 CH O H H 4-NO ₂ -C ₆ H ₄ H H H	
66 CH O H · Cl 4-NO ₂ -C ₆ H ₄ H H H .	
67 CH O H H 4-NO ₂ -C ₆ H ₄ H H CH ₃	
68 CH O H PhCH ₂ CH ₃ H H H	159-162
69 CH O H PhCH ₂ CH ₃ H H CH ₃	
70 CH O H CF ₃ CH ₂ O C ₃ H ₇ H H H	
71 CH NH H CH ₃ CH ₃ H H H	
72 CH NH H CH ₃ CH ₃ H H CH ₃	
73 CH NH H OCH ₃ CF ₃ CH ₃ H H	
74 CH NH H OCH ₃ CH ₃ F H E	
75 CH NH H H CF ₃ H H CH ₃	
76 CH NH H CH ₃ CH ₂ Cl H H H	
77 CH NH H CH ₃ CH ₂ Cl H H CH ₃	

					γ				7
78	СН	NH	Н	Cl	CH₂Cl	Н	Н	H	
79	СН	NH	Н	Н	М	CI	Н	E	
80	СН	NH	Н	Н	М	Н	Е	. н	
81	СН	NH	Н	Н	М	Н	COCH ₃	Н	
82	СН	NH	Н	Н	M	Н	Н	COCH₃	
83	СН	NH	Н	CI	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	Н	
84	СН	NH	Н	Н	4-C ₆ H ₅ Cl	Н	Н	Н	
85	СН	NH	Н	Н	4-C ₆ H ₅ Cl	Н	Н	CH ₃	
86	СН	NH	Н	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	CH ₃	
87	СН	NH	Н	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	Н	
88	СН	NH	Н	CH ₃	CH₂OCH₃	. Н	н	CH ₃	
89	СН	NH	Н	Ĥ ·	CH ₂ OCH ₃	Н	н.	Н	
90	СН	NH	.H	Н	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	Е	
91	СН	NH	Н	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	E	Н	
92	СН	ΝΉ	Н	Н	CH ₂ N(CH ₃) ₂	Н	Н	Н	
93	СН	NH	Н	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	COCH₃	
94	СН	NH	Н	CI	CH₂OC₂H₅	Н	Н	Н	
95	СН	NH	Н	Н	CH₂OC₂H₅	· H·	Н	Н	
96	СН	NH	Н	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	CH₃	-
97	СН	NH	Н	Н	CF ₃	Н	. н	CH ₃	
98	СН	NH	Н	CH ₃	CF ₃	Н	Н	Н	
99	СН	NH	Н	CH ₃	Cl	Н	Н	CH₃	
100	N	0	Н	Cl	CH ₃	Н	Н	Н	172-174
101	N	0	Н	Н	CH₃	Н.	^æ H	H	150~152
102	Ν	0	Н	Н	CH₃	Н	Н	CH ₃	178-180
103	Ν	0	Н	CH ₃	CH₃	Н	Н	Н	112~118
104	Ν	0	Н	F	CH₃	Н	Н	Н .	
105	N	0	Н	Н	CF ₃	H.	Н	Cl	
106	N	0	Н	CH₃	CH₃	Н	Н	CH ₃	184~186
107	Ν	0	ŀН	Н	CH ₃	Н	· E	ÇO₂CH₃	
108	Ν	0	Н	Н .	CH ₃	H	COCH₃	CO₂CH₃	
109	. N	0	Н	Cl	CH ₃	Н	Н	·CH ₃	198-200
110	N	0	Н	Н	CH ₂ CI	Н	Н	CO ₂ CH ₃	
111	N	.0	Н	Н	Н	Н	Н	Н	106~110
									

112	N	0	Н	Н	CH ₂ CI	Н	Н	CF ₃	
113	N	0	Н	Н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н.	CF ₃	
114	N	О	Н	CH ₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CF ₃	
115	N	О	H	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CF ₃	
116	N	0	Н	Н	CH ₂ Cl	Н	н	Н	
117	N	0	Н	Cl	, CH₂CI	Н	Н	н	·
118	N	0	Н	Cl	CH ₂ F	Н	Н	Н	
119	· N	0	Н	Н	CH₂F	Н	Н.	Н	
120	N	o	Н	Н	CH ₂ Br	Н	Н	Н	
121	N	0	Н	Н	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	CH₂N(CH₃)₂	
122	N	О	Н	Cl	CH₂OCH₃	Н	Н	CH ₂ N(CH ₃) ₂	
123	N	0	Н	CH ₃	CH₂OCH₃	Н	H	CH ₂ N(CH ₃) ₂	
124	N	0	Н	Н	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	· F	
125	N	О	Н	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	F	
126	N.	О	Н	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	Н	CO ₂ CH ₃	CH ₂ N(CH ₃) ₂	·
127	N	0	·H	Н	CH₂OCH₃	Н	Н.	Н	
128	N	0	Н	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	E	
129	N	0	Н	н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	E	· H	
130	N	0	Н	Н	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	Н	
131	N	О	Н	Н	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	COCH ₃	
132	N	О	н	Cl	CH ₂ OC ₂ H ₅ .	Н	Н	Н	
133	N.	0	· H	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	
134	N	О	Н	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	CH₃	
135	N	0	Н	Н	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	СН₃	
136	N	0	Н	CH₃	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
137	N	0	Н	CH ₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	СН3	
138	N	0	Н	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	- H	Cl	
139	N	0	Н	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	. Н	Е	
140	N	0	Н	Н	M	Н	E	Н	
141	N	0	Н	. Н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	Н .	
142	N	0	Н	Н	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	COCH ₃	
143	N	0	Н	Н	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н.	Н	
144	N	0	Н	. Н	2-Cl-C ₆ H ₄	Н	Н	Н.	·
145	N	0	Н	Н	3-CI-C ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	

146	N	0	Н	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	CH ₃	
147	N	0	Н	CH ₃ ·	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H ·	Н	Н	
148	N	0	Н	CH ₃	-CH ₂ OC ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	
149	N	0	Н	Н	-CH ₂ OC ₆ H ₄	Н	Н	. Н	
-150	Ŋ	0	Н	Н	CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₄	Н	Н	Е	
151	N	0	Н	Н	CH ₂ OCH ₂ C ₆ H ₄	Н	Е	Н	
152	N	0	Н	Н	4-Cl-C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	Н	
153	N	NH	Н	Н	CH ₃	Н	Н	Н	210-214
154	N	NH	Н	CH₃	CH ₃	Н	Н	CH ₃	178~180
155	N	NH	Н	Н .	2-CI-C ₆ H ₄	Н	Н	CH₃	
156	N	NH	Н	CH ₃	3-CI-C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
157	N	NH	Н	CH ₃	4-CI-C ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	
158	N	NH	Н	CI	CH₂CI	Н	Н	Н	-
159	N	NH	Н	CI	CH ₃	Н	Н	Н	
160	N	NH	H	Н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	Е	Н	
161	N	NH	Н	Н	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	Н	
162	N	NH	Н	Н	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	COCH ₃	
163	N	NH	Н	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	Н	
164	N	NH	Н	Н	4-F-C ₆ H ₄	Н	· H	Н	
165	N	NH	Н	Н	2-F-C ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	
166	Z	NH	Н	Н	C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂	Н	. н	CH ₃	
167	N	NH	Н	СН₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
168	N	ИИ	Н	СН₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	
169	N	NH	Н	Cl	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	Н	
170	N	NH	Н	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	Е	
171	Ν	NH	Н	Н	3,5(Cl) ₂ -C ₆ H ₃	Н	E	. Н	
172	Ν	NH	Н	Н	2,4(Cl) ₂ -C ₆ H ₃	Н	Н	Н	
173	N	NH	Н	Н	3,4(Cl) ₂ -C ₆ H ₃	H.	Н	Н	
174	N	NH	Н	Cl	CH₂OC₂H₅	Н	Н	. Н	
175	Ņ	NH	Н	H .	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	
176	N	NH	Н	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	н	СН₃	
1.77	N	NH	Н	Н	CF ₃	Н	Н	CH₃	•
178	N	ИН	Н	CH ₃	CF ₃	Н	Н	Н	
179	N	NH	Н	CH ₃	CI	Н	н.	CH ₃	

									
180	N	NH	н	Н	Cl	Н	Н	Н	
181	N	NH	Н	Н	CH ₃	Н	Н	Cl	
182	N	NH	Н	Н	C ₆ H ₅	Н	Н	Cl	
183	N	NH	Н	CH ₃	CH ₃	Н	Н	F	
184	N	NH	Н	CH ₃	CH ₃	Н	H	Н	·
185	N	NH	Н	Н	· CF ₃	Н	Н	Cl	
186	N	NH	Н	CH₃	4-F-C ₆ H ₄	Н	Н	CH₃	
187	N	NH	Н	Н	2-F-C ₆ H ₄	Н	E	CO ₂ CH ₃	
188	N	NH	Н	Н	2-Cl-C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	CO ₂ CH ₃	·
189	N	NH	Н	Н	3-Cl-C ₆ H ₄	Н	Н	CO ₂ CH ₃	
190	N	NH	Н	Н	4-CI-C ₆ H ₄	Н	Н	CO ₂ CH ₃	
191	N	NH	Н	. Н	CH ₂ Cl	Н	CH ₃	Н	·
192	N	NH	н	Н	CH₂Cl	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	CF ₃	
193	N	NH	н	н	CH₂Cl	н	Н	CF ₃	
194	N	NH	Н	CH ₃	M	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	CF ₃	
195	N	NH	Н	CH ₃	CH₂CI	Н	Н	CF ₃	
196	N.	NH	Н	H ,	CH ₂ Cl	Н	Н	Н	
197	N	ŃН	Н	Н	CH₂Cl	Н	Н	E	
198	N	NH	Н	Н	. CH₂Cl	Н	E	Н	
199	N	NH	Н	Н	CH₂Cl	Н	COCH₃	Н	
200	N	NH	Н	CH ₃	3,5-diCl-C ₆ H ₃	Н	CO₂CH₃	Н	•
201	СН	0	CH ₃	Н	Н	Н	Н	H	
202	СН	0	CH ₃	Н	CH ₃	н	Н	Н	
203	СН	0	CH ₃	Н	CH ₃	H	Н	CH₃	
204	СН	O	CH ₃	. Н	C ₆ H ₅	H	Н	CH ₃	·
205	СН	0	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	Н	Н	
206	СН	0	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	Н	СН₃	
207	СН	0	CH ₃	Н	CF₃	Н	Н	Н	
208	СН	0	CH₃	<u>.</u> H	CH ₃	Н	Н	Е	
209	СН	0	CH ₃	H	CH ₃	Н	Е	Н	
210	СН	0	CH ₃	Н	CH ₃	Н	COCH ₃	Н	•
211	СН	0	CH ₃	Н	· CH ₃	Н	Н	COCH ₃	
212	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ CI	Н	Н	Н	

		,						,	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
213	CH	0	CH₃	CI	CH₂Cl	Н	Н	Н	
214	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ Cl	Н	.H	CF ₃	
215	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ Cl	Н	Н	CH ₃	
216	СН	0	CH₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	Н	
217	СН	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	CH ₃	<u> </u>
218	СН	0	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ Cl	Н	Н	Н	
219	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ CI	Н	Н	Е	
220	СН	0	CH ₃	Н	CH₂CI	Н	Е	Н	
221	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ CI	Н	COCH ₃	Н	
222	СН	0	CH ₃	Н	CH₂CI	Н	н	соснз	
223	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	Ĥ	
224	СН	0	CH ₃	Cl	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	
225	СН	0	CH ₃	Cl	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	· CH ₃	
226	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	CH₃	
227	СН	O	CH₃	CH ₃	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	H	Н	
228	СН	0	CH₃	CH ₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CH₃	
229	СН	0	CH₃	Н	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
230	СН	0	CH₃	. Н	2-Cl-C ₆ H ₄	Н	Н	E	
231	СН	О	CH₃	Н	3-Cl-C ₆ H ₄	Н	E	Н	
232	СН	0	CH₃	Н	CF ₃	Н	COCH₃	Н	(
233	СН	0	CH₃	Cl	CH₂OCH₃	Н	Н	COCH ₃	B
234	СН	0	CH ₃	OCH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	
235	СН	О	CH₃	C₂H₅	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	CH ₃	Н	
236	СН	0	CH₃	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н .	CH ₃	
237	СН	0	CH ₃	Cl	CH ₂ OC ₂ H ₅	H	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	
238	СН	0	CH ₃	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄	Н	Н	Н	*
239	СН	0	CH ₃	CH₃	3-F-C ₆ H ₄	Н	Н	CH₃	
.240	СН	0	CH ₃	Н	4-F-C ₆ H₄	H,	н	Н	
241	СН	0	CH ₃ .	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	E	
242	СН	.0	CH ₃	Н	.CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Ε.	Н	
243	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	H	COCH ₃	Н	
244	СН	0	CH ₃	Н	. CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	COCH ₃	
245	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	Н	

246	СН	0	CH ₃	CI	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	Н	
247	СН	0	CH ₃	Н	CF ₃	Н	Н	CH₃	
248	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	CH₃	
249	СН	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	Н	
250	СН	0	CH ₃	CH ₃	-CH ₂ OPh	Н	Н	CH ₃ .	
251	СН	0	CH₃	Н	-CH ₂ OPh	H.	Н	Н	
252	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ Ph	Н	Н	Е	
253	СН	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ Ph	Н	E	Н	
254	СН	0	CH ₃	Н	4-CI-C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	Н	
255	СН	0	CH ₃	Н	4-CI-C ₆ H ₄	Н	Н	COCH₃	
256	СН	0	CH ₃	Н	М	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	Н	
257	СН	0	CH ₃	Н	М	Н	Н	Н	
258	СН	0	CH₃	CI	М	Н	Н	CH ₃	•
259	СН	0	CH ₃	Н	М	Н	Н	CH ₃	
260	СН	0	CH ₃	CH ₃	М	Н	Н	Н	
261	СН	NH	CH ₃	Cl	Н	Н	Н	Н	
262	СН	NH	CH ₃	Cl	CH ₃	Н	Н	Н	
263	СН	NH	CH ₃	Н	CH₃	Н	Н	CH ₃	
264	СН	NH	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	Н	Н	CH₃	
265	СН	NH	CH ₃	CH₃	CH ₃	Н	Н	Н	
266	СН	NH	CH ₃	CH₃	CH ₃	Н	н	CH ₃	
267	СН	NH	CH ₃	OCH ₃	CF ₃	Н	Н	Н	
268	СН	NH	CH ₃	OCH₃	CH ₃	Н	Н	Е	
269	СН	NH	CH ₃	Н	CH ₃	Н	Е	Н	
270	СН	NH	CH ₃	Н	CH ₃	Н	COCH ₃	н	
271	СН	NH	CH ₃	Н	CH ₃	Ή	Н	COCH ₃	
272	СН	NH	CH ₃	Н	CH ₂ Cl	Н	Н	Н	
273	СН	NH	CH ₃	Н	М	Н	Н	Н	
274	СН	ΝН	CH ₃	Н	CH ₂ CI	Н	Н	CH ₃	
275	.CH	NH	CH ₃	Н.	CF ₃	Н	Н	ĊH ₃	
276	СН	NH	CH ₃	CH ₃	· CH ₂ CI	Н	Н	Н	
277	СН	NH	CH ₃	CH ₃	CH₂CI	H	Н	CH ₃	
278	СН	NH	CH ₃	Cl	CH ₂ CI	Н	Н	Н	
279	СН	NH	CH₃ -	Н	М	Н	Н	E	_
			L				<u>-</u> -		

280	СН	NH	CH ₃	Н	М	Н	Е	Н	
281	СН	NH	CH₃	Н	. M	. Н	COCH ₃	Н	
282	СН	NH	CH ₃	Н	М	Н	Н	COCH ₃	
283	СН	NH	CH ₃	Cl	CH ₂ OCH ₃	Н	н	H.	
284	СН	NH	CH ₃	Н	4-C ₆ H ₅ Cl	Н	H	Н	
285	СН	NH	CH ₃	Н	4-C ₆ H ₅ Cl	Н	н	CH₃	
286	СН	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	CH₃	
287	СН	NH	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	Н	н	Н	
288	СН	NH	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	CH ₃	
289	СН	NH	CH ₃	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	Н	
290	СН	NH	CH ₃	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	Е	
291	СН	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	E	Н	
292	СН	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	COCH ₃	Н	
293	СН	NH	CH ₃	Н	CH₂OCH₂CF₃	Н	. Н	COCH ₃	
294	СН	NH	CH₃	Cl	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	H	
295	·СН	NH	CH₃	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	H	Н	
296	СН	NH	CH ₃	Н	· CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	H	CH ₃	
297	СН	ΝН	CH₃	Н	CF ₃	H	Н	CH ₃	
298	СН	NH	CH ₃	CH ₃	CF ₃	Н	Н	Н	
299	СН	NH	CH ₃	CH₃	Cl	Н	Н	CH₃	
300	СН	ИН	CH ₃	Н	Cl	Н	Н	Н	
301	Z	0	CH₃	H	CH₃	Н	Н	Н	
302	Z	0	CH₃	Н	C ₆ H ₅	Н	Н	CI	
303	N	0	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	Н	Н	
304	N	0	CH₃	CḤ₃	CH₃	Н	Н	Н	
305	N	·O	CH ₃	Н	CF ₃	Н	Н	CI	·
306	N	0	CH ₃	CH₃	CH ₃	Н	н	CH ₃	
307	Ν	0	CH ₃	Н	CH₃	Н	Е	CO ₂ CH ₃	
308	Ν,	0	CH ₃	Н	CH₃	Н	COCH ₃	CO ₂ CH ₃	
309	N	0	CH ₃	Н	CH₃	Н	н.	CO ₂ CH ₃	
310	N	0	CH ₃	Н	CH₂Cl	Н	Н	CO ₂ CH ₃	
311	N	0	CH ₃	Н	Н	Н	Н	Н	
312	Ν	0	CH ₃	Н	CH₂CI	Н	Н	CF ₃	
313	Ν	0	CH ₃	Н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CF ₃	

314	N	0	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CF ₃	
315	N	O	·CH ₃	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CF ₃	
316	N	0	CH ₃	Н	CH₂CI	Н	Н	Н	
317	N	0	CH ₃	Н	CH ₂ CI	Н	Н	Ë	
318	N	0	·CH ₃	Н	CH₂Cl	Н	Е	Н	
319	N	0	CH ₃	Н	CH ₂ Cl	Н	COCH ₃	Н	
320	N	0	CH ₃	Н	. CH ₂ CI	Н	Н	сосн3	
321	N	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	CH ₂ N(CH ₃) ₂	. /
322	N	0	CH ₃	Cl	CH₂OCH₃	Н	Н	CH ₂ N(CH ₃) ₂	
323	N	0	CH ₃	CH ₃	CH₂OCH₃	Н	Н	CH ₂ N(CH ₃) ₂	
324	N	0	CH ₃	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	F	
325	N	0	CH ₃	CH ₃	CH₂OCH₃	Н	Н	F	
326	N	0	CH ₃	CH₃	CH₂OCH₃	Н	CO ₂ CH	CH₂N(CH₃)₂	
327	N	0	CH ₃	Н	CH₂OCH₃	Н	Н	Н	
328	N	0	CH ₃	Н	CH₂OCH₃	Н	н	E	
329	N	0	CH ₃	Н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	Е	Н	-
330	N	0	CH ₃	Н	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	Н	
331	N	О	CH ₃	Н	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	COCH₃	
332	N	0	CH ₃	Cl	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	
333	N	Ó	CH₃	Н	CH₂OC₂H₅	Н	Н	Н	
334	N	0	CH ₃	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	CH₃	
335	N	0	CH ₃	Н	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄ .	Н	Н	CH₃	
336	N	0	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	Н	-
337	N	0	CH ₃	CH ₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	
338	N	0	CH ₃	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Cl	-
339	N·	0	CH ₃	. Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	н	E	
340	N	0	CH ₃	Н	М	Ĥ	E.	Н	
341	N	O.	CH ₃	Н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	Н	
342	N	0	CH ₃	Н	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	COCH ₃	
343	N	0	CH ₃	Н	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	н	. н	
344	N	0	СН₃	Н	2-Cl-C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
345	N	0	CH ₃	Н	3-Cl-C ₆ H₄	Н	Н	CH ₃	_
346	N	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	. H	CH ₃	

347 N O CH ₃ CH ₃ CH ₂ OCH ₃ CF ₅ H H H 348 N O CH ₃ CH ₃ CH ₂ OPh H H CH ₅ 349 N O CH ₃ H CH ₂ OPh H H H 350 N O CH ₃ H CH ₂ OPh H H H 351 N O CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ Ph H E H 352 N O CH ₃ H CH ₂ CH ₄ H COCH ₃ H 353 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ H H CH ₃ 354 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ H H CH ₃ 355 N NH CH ₃ CH ₃ 3-C-C ₄ H ₄ H H H H H H H H H CH ₃ CH ₃ C										
349 N O CH ₃ H -CH ₂ OPh H -H -H E 350 N O CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ Ph H -E H 351 N O CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ Ph H -E H 352 N O CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ Ph H -E H 353 N NH CH ₃ H -CH ₂ OCH ₂ Ph H -E H 354 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃ H -CH ₂ OCH ₄ H -CH ₃ 355 N NH CH ₃ H -CCC ₆ H ₄ H -H -CH ₃ 356 N NH CH ₃ CH ₃ 3-CH ₂ C ₆ H ₄ H -H -CH ₃ 357 N NH CH ₃ H -CH ₂ CL-C ₆ H ₄ H -H -CH ₃ 358 N NH CH ₃ H -CH ₂ CL-C ₆ H ₄ H -H -CH ₃ 359 N NH CH ₃ H -CH ₂ CL-C ₆ H ₄ H -H -CH ₃ 360 N NH CH ₃ H -CH ₂ CL-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ H -CH ₂ CL-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ 361 N NH CH ₃ H -CH ₂ CL-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ H -COCH ₃ 362 N NH CH ₃ H -CH ₂ CC-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ H -COCH ₃ 363 N NH CH ₃ H -CH ₂ CC-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ H -COCH ₃ 364 N NH CH ₃ H -CH ₂ CC-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ 365 N NH CH ₃ H -CH ₂ CC-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ 366 N NH CH ₃ H -CH ₂ CC-C ₆ H ₄ H -COCH ₃ 367 N NH CH ₃ H -C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H -H -H -CH ₃ 368 N NH CH ₃ H -C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H -CH ₃ 369 N NH CH ₃ H -C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H -CH ₃ 369 N NH CH ₃ H -C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H -CC-C ₆ H ₄ H -CC-C ₆ H ₄ 370 N NH CH ₃ H -C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H -CC-C ₆ H ₄ 371 N NH CH ₃ H -C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H -CC-CC-C ₆ H ₄ 372 N NH CH ₃ H -C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H -CC-CC-CC-CC-CC-CC-CC-CC-CC-CC-CC-CC-CC	347	Ν	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	Н	
339 N O CH3 H CH2OCH2Ph H E H 351 N O CH3 H CH2OCH2Ph H E H 352 N O CH3 H CH2OCH2Ph H E H 353 N NH CH3 H A-CH2OCH2Ph H E H 354 N NH CH3 H A-CH2OCH2Ph H H H H 355 N NH CH3 CH3 CH3 CH3 H H CH3 356 N NH CH3 CH3 CH3 A-CH2OH4 H H CH3 357 N NH CH3 CH3 CH3 A-CH2OH4 H H H CH3 358 N NH CH3 H CH2OCH2 H H H H E 360 N NH CH3 H A-CH2OCH4 H E H E H 360 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H E H COCH3 361 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H H COCH3 362 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H H COCH3 363 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H H H COCH3 364 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H H H COCH3 365 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H H H COCH3 366 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H H H COCH3 367 N NH CH3 H A-CH3-CeH4 H H H H 368 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H 368 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H 369 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H 360 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H 361 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 362 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 363 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 365 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 366 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 367 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 368 N NH CH3 CH3 C-COCH3-CeH4 H H H H H 370 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 370 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 371 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 372 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 373 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 374 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 375 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 376 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 377 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 377 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H 378 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H H 379 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H H 370 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H H 371 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H H 372 N NH CH3 H C-F-CeH4 H H H H H H 373 N NH C-F-CeH4 H H H H H H H H 374 N NH C-F-CeH4 H H H H H H H H H H H H H H H H H H	348	N	0	CH ₃	CH ₃	-CH₂OPh	Н	Н	CH₃	
351 N O CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ Ph H E H H 352 N O CH ₃ H 4-Cl-C ₆ H ₄ H COCH ₃ H 353 N NH CH ₃ H CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃ 354 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃ H H CH ₃ 355 N NH CH ₃ H 2-Cl-C ₆ H ₄ H H CH ₃ 356 N NH CH ₃ CH ₃ 3-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 357 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ 3-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 358 N NH CH ₃ H CH ₂ Cl H H H H E 360 N NH CH ₃ H 3-CF ₅ -C ₆ H ₄ H E E H 361 N NH CH ₃ H 3-CF ₅ -C ₆ H ₄ H COCH ₃ 362 N NH CH ₃ H 4-CH ₂ Cc ₀ H ₄ H H COCH ₃ 363 N NH CH ₃ H 4-CH ₂ Cc ₀ H ₄ H H H COCH ₃ 364 N NH CH ₃ H 4-F-C ₆ H ₄ H H H H H 365 N NH CH ₃ H 4-F-C ₆ H ₄ H H H H H 366 N NH CH ₃ H 2-F-C ₆ H ₄ H H H H H 367 N NH CH ₃ H 2-F-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 368 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H H CH ₃ 369 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₃ CCH ₃ H H H H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₃ CCH ₃ H H H H CH ₃ 372 N NH CH ₃ H CH ₃ CCH ₃ H H H H CH ₃ 373 N NH CH ₃ H CH ₃ CCH ₃ H H H H H H 374 N NH CH ₃ H CH ₃ CCH ₃ H H H H CH ₃ 375 N NH CH ₃ H CH ₃ CCH ₃ H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	349	Ν	0	CH ₃	Н	-CH₂OPh	Н	H	Н	
352 N O CH ₃ H 4-Cl-C ₆ H ₄ H COCH ₃ H H CH ₃ 353 N NH CH ₃ H CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃ H H CH ₃ 355 N NH CH ₃ H 2-Cl-C ₆ H ₄ H H CH ₃ 356 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ 3-Cl-C ₆ H ₄ H H CH ₃ 357 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ 3-Cl-C ₆ H ₄ H H CH ₃ 358 N NH CH ₃ H CH ₂ Cl H H H E 360 N NH CH ₃ H 3-CF ₂ -C ₆ H ₄ H COCH ₃ H E 361 N NH CH ₃ H 3-CF ₂ -C ₆ H ₄ H COCH ₃ H E 362 N NH CH ₃ H 3-CF ₂ -C ₆ H ₄ H COCH ₃ H 363 N NH CH ₃ H 3-CH ₂ -C ₆ H ₄ H COCH ₃ H 364 N NH CH ₃ H 4-F-C ₆ H ₄ H H H 365 N NH CH ₃ H 4-F-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 366 N NH CH ₃ H 2-F-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 367 N NH CH ₃ H C ₆ -S ₃	350	N	0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ Ph	Н	Н	E	
353 N NH CH3 H CH3 H H CH3 354 N NH CH3 CH3 CH3 CH3 H H CH3 355 N NH CH3 H 2-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH3 356 N NH CH3 CH3 3-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH3 357 N NH CH3 CH3 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH3 358 N NH CH3 H CH2Cl H H H H 359 N NH CH3 H 3-CF3-C ₆ H ₄ H E H 360 N NH CH3 H 3-CF3-C ₆ H ₄ H E H 361 N NH CH3 H 3-CF3-C ₆ H ₄ H H COCH3 H 362 N NH CH3 H 4-CH3-C ₆ H ₄ H H H COCH3 363 N NH CH3 H 4-CH3-C ₆ H ₄ H H H COCH3 364 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H H CH3 365 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H H CH3 366 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H H CH3 367 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH3 368 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H CH3 369 N NH CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 360 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH3 361 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 362 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 363 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 364 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 365 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 366 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 367 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 368 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 370 N NH CH3 CH CH3 CH3-C ₆ H ₄ H H H CH3 371 N NH CH3 H CH2-OCH3 H H H H 372 N NH CH3 H CH2-OCH3 H H H H 373 N NH CH3 H CH2-OCH3-CF3 H COCH3 H 373 N NH CH3 H CH2-OCH3-CF3 H COCH3 H 374 N NH CH3 H CH2-OCH3-CF3 H H H H 375 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 376 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 377 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 378 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 379 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 370 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 371 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 372 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 373 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 374 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 375 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H 376 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H CH3 377 N NH CH3 H CH2-OCH3-H H H H CH3 378 N NH CH3 CH3 CH3 CH3 CH3 378 N NH CH3 CH3 CH3 CH3 378 N NH CH3 CH3 CH3 CH3 378 N NH CH3 CH3 CH3 CH3 379 CH3-CH3-CH3-CH3-CH3-CH3-CH3-CH3-CH3-CH3-	351	N	. 0	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ Ph	Н	E	Н	·
354 N NH CH3 CH3 CH3 CH3 H H CH3 355 N NH CH3 H 2-CI-C ₆ H ₄ H H H CH3 356 N NH CH3 CH3 3-CI-C ₆ H ₄ H H H CH3 357 N NH CH3 CH3 4-CI-C ₆ H ₄ H H H CH3 358 N NH CH3 H CH ₂ CI H H H E 359 N NH CH3 H 3-CF ₂ -C ₆ H ₄ H E H 360 N NH CH3 H 3-CF ₂ -C ₆ H ₄ H E H 361 N NH CH3 H 3-CF ₃ -C ₆ H ₄ H COCH ₃ H 362 N NH CH3 H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ 363 N NH CH3 H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ 364 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H H H 365 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H CH3 366 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H H CH ₃ 367 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H H CH ₃ 368 N NH CH3 CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH3 369 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H CH3 368 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH3 369 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH3 370 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H H CH3 371 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H E H 372 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H E H 373 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H E H 374 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H E H 375 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 376 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 377 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 378 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 379 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 370 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 371 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 372 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 373 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 374 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H E H 375 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H H 376 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₃ H H 377 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 378 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 379 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 370 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 371 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 372 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 373 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 374 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 375 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H 376 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 377 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 378 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 379 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 370 NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 371 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 371 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 371 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H ₅ H H H 372 N NH CH3 H CH ₂ OC ₃ H	352	N	0	CH ₃	Н	4-Cl-C ₆ H ₄	Н	COCH₃	Н	
355 N NH CH ₃ H 2-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 356 N NH CH ₃ CH ₃ 3-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 357 N NH CH ₃ CH ₃ 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 358 N NH CH ₃ H CH ₂ Cl H H H E 359 N NH CH ₃ H 3-CF ₃ -C ₆ H ₄ H E H 360 N NH CH ₃ H 3-CF ₃ -C ₆ H ₄ H E H 361 N NH CH ₃ H 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ H COCH ₃ H 362 N NH CH ₃ H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ 363 N NH CH ₃ H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H H COCH ₃ 364 N NH CH ₃ H 4-F-C ₆ H ₄ H H H H 365 N NH CH ₃ H 2-F-C ₆ H ₄ H H CH ₃ 366 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH ₃ 367 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH ₃ 368 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH ₃ 369 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH ₃ 370 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 371 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 373 N NH CH ₃ H CH ₃ OCH ₃ H COCH ₃ H H H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 378 N NH CH ₃ CI CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 379 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 378 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 379 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 378 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 379 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 372 N N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H	353	N	NH	CH ₃	Н	CH ₃	Н	Н	H	
356 N NH CH ₃ CH ₃ 3-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 357 N NH CH ₅ CH ₃ 4-Cl-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 358 N NH CH ₅ H CH ₂ Cl H H H E 359 N NH CH ₃ H M H H E 360 N NH CH ₃ H 3-CF ₃ -C ₆ H ₄ H E H 361 N NH CH ₃ H 3-CF ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ H 362 N NH CH ₃ H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ H 363 N NH CH ₃ H 4-CH ₂ -C ₆ H ₄ H H H COCH ₃ 363 N NH CH ₃ H 4-F-C ₆ H ₄ H H H H 364 N NH CH ₃ H 2-F-C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 365 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H H H 365 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH ₃ 366 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 367 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH ₃ 368 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H CH ₃ 369 N NH CH ₃ CH CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H E 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H H E 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H H E 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 378 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 379 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 378 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 379 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H H H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H H	354	N	NH	CH _{3.}	CH ₃	CH ₃	Н	Н	CH ₃	
357 N NH CH3 CH3 4-CI-C ₆ H ₄ H H CH3 358 N NH CH3 H CH ₂ CI H H H E 359 N NH CH3 H 3-CF ₃ -C ₆ H ₄ H E H 360 N NH CH3 H 3-CF ₃ -C ₆ H ₄ H E H 361 N NH CH3 H 3-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ 362 N NH CH3 H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ 363 N NH CH3 H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 364 N NH CH3 H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 365 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H H 365 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H H CH ₃ 366 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H H CH ₃ 367 N NH CH3 CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 368 N NH CH ₃ CH ₃ COCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 369 N NH CH ₃ CH CH ₃ COCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 370 N NH CH ₃ CH CH ₃ COCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 371 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H E H 372 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(CI) ₂ H E H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H COCH ₃ H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H COCH ₃ H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H COCH ₃ H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H 378 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H 379 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H H 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ -C ₇ H H H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ -H ₅ H H H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ -H ₅ H H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ -H ₅ H H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CCH ₃ CCF ₃ H H H CH ₃	355	N	NH	CH ₃	Н	2-Cl-Ç ₆ H ₄	Н	н .	CH ₃	
358 N NH CH3 H CH2CI H H H E 359 N NH CH3 H M H H E 360 N NH CH3 H 3-CF3-C6H4 H E H 361 N NH CH3 H 3-CH3-C6H4 H COCH3 H 362 N NH CH3 H 4-CH3-C6H4 H H COCH3 363 N NH CH3 H 4-F-C6H4 H H H 364 N NH CH3 H 4-F-C6H4 H H H 365 N NH CH3 H 2-F-C6H4 H H H 366 N NH CH3 H CH3-3-5(CI)2 H H H H 367 N NH CH3 H CH3-3-5(CI)2 H H CH3 368 N NH CH3 CH3 CH3 C-CH4 H H H CH3 369 N NH CH3 CH3 CH3 C-CCH4 H H H H 368 N NH CH3 CH3 CH3 C-CCH3-C6H4 H H H CH3 369 N NH CH3 CH3 CH3 C-CCH3-C6H4 H H H CH3 370 N NH CH3 H CH3-CH3-CCCH3-CCH4 H H H CH3 371 N NH CH3 H CH3-CCCCH3-CCH4 H H H CH3 372 N NH CH3 H CH3-CCCCCH3-CCCH4 H H H H 373 N NH CH3 H CH3-CCCCCCCCCCCCCCCCCCCCCCCCCCCC	356	N	NH	CH ₃	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
358 N NH CH3 H M H H E 360 N NH CH3 H 3-CF3-C6H4 H E H 361 N NH CH3 H 3-CF3-C6H4 H E H 362 N NH CH3 H 4-CH3-C6H4 H H COCH3 H 362 N NH CH3 H 4-CH3-C6H4 H H COCH3 363 N NH CH3 H 4-F-C6H4 H H H H 364 N NH CH3 H 2-F-C6H4 H H CH3 365 N NH CH3 H 2-F-C6H4 H H H CH3 366 N NH CH3 H C6H3-3,5(Cl)2 H H CH3 367 N NH CH3 H C6H3-3,5(Cl)2 H H CH3 368 N NH CH3 CH3 2-OCH3-C6H4 H H H 368 N NH CH3 CH3 2-OCH3-C6H4 H H H 370 N NH CH3 H C6H3-3,5(Cl)2 H H E 371 N NH CH3 H C6H3-3,5(Cl)2 H E H 372 N NH CH3 H CCH3-3,5(Cl)2 H E H 373 N NH CH3 H CCH3-3,5(Cl)2 H E H 374 N NH CH3 H CCH3-3,5(Cl)2 H E H 375 N NH CH3 H CH3-3,5(Cl)2 H E H 376 N NH CH3 H CCH3-3,5(Cl)2 H E H 377 N NH CH3 H CH3-3CH3 H COCH3 H H 378 N NH CH3 H CH3-3CH3 H COCH3 379 N NH CH3 H CH3-3CH3 H COCH3 370 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H 371 N NH CH3 H CH3-3CH3 H COCH3 372 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H 373 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H 375 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H 376 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H 377 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 378 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 379 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 370 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 371 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 372 N NH CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 373 N NH CH3 H CH3-3CH3 H CH3-3CH3 H COCH3 374 N NH CH3 H CH3-3CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 375 N NH CH3 H CH3-3CH3 H CH3-3CH3 H H H H H 376 N NH CH3 H CH3-3CH3 H CH3-3CH3 H H H H H H	357	N	NH	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	
360 N NH CH3 H 3-CF3-C6H4 H E H 361 N NH CH3 H 3-CH3-C6H4 H COCH3 H 362 N NH CH3 H 4-CH3-C6H4 H H COCH3 363 N NH CH3 H 4-CH3-C6H4 H H H 364 N NH CH3 H 4-F-C6H4 H H H 365 N NH CH3 H 2-F-C6H4 H H CH3 366 N NH CH3 H C6H3-3,5(Cl) ₂ H H CH3 367 N NH CH3 CH3 2-OCH3-C6H4 H H H 368 N NH CH3 CH3 2-OCH3-C6H4 H H H 368 N NH CH3 CH3 2-OCH3-C6H4 H H H 370 N NH CH3 H C6H3-3,5(Cl) ₂ H H E 371 N NH CH3 H CH2-CH3 H H H 372 N NH CH3 H CH3-C6H4 H H H 373 N NH CH3 H CH3-C6H3 H H H 374 N NH CH3 H CH3-C6H3 H H H 375 N NH CH3 H CH2-OCH3 H H H 376 N NH CH3 H CH3-OCH3 H H H 377 N NH CH3 H CH2-OCH3-CF3 H COCH3 H 378 N NH CH3 H CH2-OCH3-CF3 H H H 379 N NH CH3 H CH3-OCH3-CF3 H H H 370 N NH CH3 H CH3-OCH3-CF3 H H H 371 N NH CH3 H CH3-OCH3-CF3 H H H H 375 N NH CH3 H CH2-OCH3-CF3 H H H H 376 N NH CH3 H CH2-OCH3-CF3 H H H H 377 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 378 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 379 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 370 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 371 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 372 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 373 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 374 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 375 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 376 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 377 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 378 N NH CH3 CH3 CH3-OC-2-H5 H H H 379 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 370 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 371 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 372 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 373 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 374 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 375 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 376 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 377 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 378 N NH CH3 CH3-OC-2-H5 H H H 379 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 370 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 371 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H H 372 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H 373 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H 374 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H 375 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H 376 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H 377 N NH CH3 H CH3-OC-2-H5 H H 378 N NH CH3 CH3-OC-2-H5 H H 379 N NH CH3 CH3-OC-2-H5 H 370 N NH CH3 CH3-OC-2-H5 H 370 N NH CH3-OC-	358	N	NH	CH ₃	Н	CH₂Cl	H	Н	Н .	
360 N NH CH3 H 3-CH3-C ₆ H ₄ H COCH3 H 362 N NH CH3 H 4-CH3-C ₆ H ₄ H H COCH3 363 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₃ H H H 364 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H H 365 N NH CH3 H 2-F-C ₆ H ₄ H H CH3 366 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH3 367 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 368 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH3 369 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH3 370 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H E 371 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 373 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 373 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 373 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 374 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 375 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H COCH ₃ 376 N NH CH3 H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 377 N NH CH3 H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 378 N NH CH3 CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH3 CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₄ 378 N NH CH3 CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₄ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H 379 CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₄ CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₄ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₄ 379 CH ₄ CH ₄ CH ₄ 370 CH ₄ 370 CH ₄ CH ₄ 370 CH	359	N	NH	CH ₃	Н	М	Н	Н	Е	
362 N NH CH ₃ H 4-CH ₃ -C ₆ H ₄ H H COCH ₃ 363 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H H 364 N NH CH ₃ H 4-F-C ₆ H ₄ H H H 365 N NH CH ₃ H 2-F-C ₆ H ₄ H H CH ₃ 366 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH ₃ 367 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 368 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH ₃ 369 N NH CH ₃ Cl CH ₂ OCH ₃ H H CH ₃ 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H E 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H E 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H H 378 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H CH ₃ 379 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 371 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 376 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃	360	N	NH	CH ₃	Н	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	Н	Е	Н	
363 N NH CH3 H CH2OCH3 H H H 364 N NH CH3 H 4-F-C6H4 H H H 365 N NH CH3 H 2-F-C6H4 H H CH3 366 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH3 367 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH3 368 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH3 369 N NH CH3 CI CH ₂ OCH ₃ H H CH3 370 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 371 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 373 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 374 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H COCH ₃ 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 377 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CCH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ CF ₃ H H CCH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H CCH ₃	361	N	NH	CH ₃	Н.	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	· COCH ₃	Н	
363 N NH CH3 H 4-F-C ₆ H ₄ H H H H 365 N NH CH3 H 2-F-C ₆ H ₄ H H H CH3 366 N NH CH3 H C ₆ H ₃ ·3,5(Cl) ₂ H H CH3 367 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ ·C ₆ H ₄ H H H 368 N NH CH3 CH3 2-OCH ₃ ·C ₆ H ₄ H H CH3 369 N NH CH3 CI CH ₂ OCH ₃ H H 370 N NH CH3 H C ₆ H ₃ ·3,5(Cl) ₂ H E H 371 N NH CH3 H C ₆ H ₃ ·3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 374 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 375 N NH CH3 H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH3 H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 377 N NH CH3 H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 378 N NH CH3 CH3 CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH3 CH3 CF ₃ CF ₃ H H CH4 CH ₃ 378 N NH CH3 CH3 CF ₃ CF ₃ H H H 378 CH ₂ OC ₄ CF ₃ H H CH ₃ CH ₄ CF ₃ CH ₄ CH ₄ CH ₄ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₄ CH ₄ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₄ CH ₄ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ CH ₄ CH ₄ CH ₄ 379 CH ₄ CH ₄ CH ₄ 370 CH ₄ CH ₄ CH ₄ 377 CH ₄ CH ₄ CH ₄ CH ₄ 378 CH ₄ CH ₄ CH ₄ CH ₄ 378 CH ₄ CH ₄ CH ₄ 379 CH ₄ CH ₄ CH ₄ 370 CH ₄ 370 CH ₄ CH ₄	362	N	NH	CH ₃	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	COCH ₃	
365 N NH CH ₃ H 2-F-C ₆ H ₄ H H CH ₃ 366 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH ₃ 367 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 368 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH ₃ 369 N NH CH ₃ Cl CH ₂ OCH ₃ H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H E 371 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H CF ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ CF ₃ H H CH ₄ 379 CH ₄ CH ₅ CH ₅ CH ₅ 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H CH ₄ 371 CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H COCH ₅ 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H CH ₅ 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H CH ₅ 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H CH ₅ 377 N NH CH ₃ H CH ₃ CF ₃ CF ₃ H H CH ₅ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ CF ₃ H H CCH ₅ 379 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 370 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 371 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 372 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 373 CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ 374 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 375 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 376 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 377 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 378 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 379 CH ₅ CH ₅ 370 CH ₅ CH ₅ 370 CH ₅ CH ₅ 371 CH ₅ CH ₅ 372 CH ₅ CH ₅ 373 CH ₅ CH ₅ CH ₅ 374 CH ₅ CH ₅ 375 CH ₅ CH ₅ 376 CH ₅ CH ₅ 377 CH ₅ CH ₅ 378 CH ₅ CH ₅ 378 CH ₅ CH ₅ 379 CH ₅ CH ₅ 370 CH ₅ CH ₅ 370 CH ₅ CH ₅ 370 CH ₅ CH ₅ 371 CH ₅ CH ₅ 372 CH ₅ 373 CH ₅ CH ₅ 374 CH ₅ CH ₅ 375 CH ₅ 376 CH ₅ 377 CH ₅ 377 CH ₅ 378 CH	363	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₃	. Н	Н	Н	
366 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H H CH ₃ 367 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H H 368 N NH CH ₃ CH ₃ 2-OCH ₃ -C ₆ H ₄ H H CH ₃ 369 N NH CH ₃ Cl CH ₂ OCH ₃ H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H E 371 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ 374 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H COCH ₃ 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH CH ₃ CF ₃ H H CH 378 N NH CH ₃ CH CH ₃ CF ₃ H H CH 378 N NH CH ₃ CH ₃ CCH ₃ CF ₃ H H CCH ₄ 379 CH 370 CH 371 N NH CH ₃ CH 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H CH ₃	364	N	NH	CH₃	Н	4-F-C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
367 N NH CH3 2-OCH3-C6H4 H H H 368 N NH CH3 2-OCH3-C6H4 H H CH3 369 N NH CH3 CI CH2OCH3 H H H 370 N NH CH3 H CH2OCH3 H H E 371 N NH CH3 H CH2OCH3 H E H 372 N NH CH3 H CH2OCH2CF3 H COCH3 H 373 N NH CH3 H CH2OCH2CF3 H H H H 374 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H H H 375 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H H CH3 377 N NH CH3 H CF3 H H CH4	365	N	NH	CH ₃	Н	2-F-C ₆ H ₄	Н	Н	CH₃	
367 N NH CH3 2-OCH3-C6H4 H H CH3 368 N NH CH3 2-OCH3-C6H4 H H CH3 369 N NH CH3 CI CH2OCH3 H H H 370 N NH CH3 H CH2OCH3 H H E 371 N NH CH3 H CGH3-3,5(CI)2 H E H 372 N NH CH3 H CH2OCH2CF3 H COCH3 H 373 N NH CH3 H CH2OC2C2F3 H H H H 374 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H H H 375 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H CH3 377 N NH CH3 CH3 CF3 H H CH4	366	N	NH	CH₃	Н	C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂	Н	Н	CH₃	
369 N NH CH ₃ CI CH ₂ OCH ₃ H H H 370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H E 371 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H COCH ₃ 374 N NH CH ₃ CI CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H 379 CH ₃ CH ₄ CH ₅ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ CH ₄ CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ 379 CH ₅ CH	367	N	NH	CH ₃	CH₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	Н	
370 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₃ H H E 371 N NH CH ₃ H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H COCH ₃ 374 N NH CH ₃ CI CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H 378 N NH CH ₃ CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H 379 CH ₄ CH ₄ CH ₅ 370 CH ₄ CH ₅ CH ₅ 371 CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ 372 CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₅ 373 CH ₅ 375 CH ₅	368	N	NH	CH ₃	CH₃	2-OCH ₃ -C ₆ H ₄	Н	Н	CH₃	
370 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 371 N NH CH3 H C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂ H E H 372 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H COCH ₃ H 373 N NH CH3 H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H COCH ₃ 374 N NH CH3 CI CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 375 N NH CH3 H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H CH ₃	369	N	NH	CH ₃	Cl .	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	н	
371 N NH CH3 H C613 3,5(C)2 H COCH3 H 372 N NH CH3 H CH2OCH2CF3 H COCH3 H 373 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H H H 374 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H H H 375 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H H CH3 376 N NH CH3 H CF3 H H CH3 377 N NH CH3 CH3 CF3 H H H 378 N NH CH3 CH3 CF3 H H H	370	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₃	Н	Н	Е	
372 N NH CH ₃ H CH ₂ OCH ₂ CF ₃ H H COCH ₃ 373 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CCF ₃ H H H CH ₄ CH ₅ CH ₅ CH ₄ CCH ₅ CH ₅ CH ₅ CH ₆ CH ₆ CH ₆ CCH	371	N	NH	CH ₃	Н	C ₆ H ₃ -3,5(Cl) ₂	Н	Е	Н	
373 N NH CH3 CI CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H CH 378 N NH CH ₃ CH ₃ CCF ₃ H H H CH ₄ CH ₅ CH	372	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	COCH ₃	Н	<u> </u>
374 N NH CH ₃ CI CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 375 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H H 376 N NH CH ₃ H CH ₂ OC ₂ H ₅ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H	373	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Н	Н	COCH ₃	
375 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H CH3 376 N NH CH3 H CH2OC2H5 H H CH3 377 N NH CH3 H CF3 H H CH3 378 N NH CH3 CH3 CF3 H H H 378 N NH CH3 CH3 CH3 CF3 H H CH4	374	N	NH	CH ₃	CI	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н	
376 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 377 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H CH ₄ CH ₄ CH ₄ CH ₅	375	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	Н	Н	Н.	
377 N NH CH ₃ H CF ₃ H H CH ₃ 378 N NH CH ₃ CH ₃ CF ₃ H H H CH ₄ CH ₄ CH ₄ CH ₄ CH ₄	376	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ OC ₂ H ₅	H,	Н	CH ₃	
3/8 N NH CH3 CH3 CH3 CH4	<u> </u>	 	NH	CH ₃	Н	CF ₃	Н	Н	CH ₃	
379 N NH CH ₃ CH ₃ Cl H H CH ₃	378	N	NH	CH ₃	CH ₃	CF ₃	Н	Н	Н	
	379	N	NH	CH ₃	CH ₃	. Cl	Н	Н	CH ₃	
380 N NH CH ₃ -H CI H H H	780	N	NH	CH ₃	-Н	Cl	Н	Н	Н	

									
381	N	NH	CH ₃	Н	CH₃	Н	Н	Cl	
382	N	NH	CH ₃	Н	C ₆ H ₅	Н	Н	CI	
383	N	NH	CH ₃	CH₃	CH ₃	Н	H	F	
384	N	NH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Н	Н	. Н	
385	N	NH	CH ₃	Н	CF ₃	Н	Н	Cl	
386	N	NH	CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄	Н	Н	CH ₃	
387	N	NH	CH ₃	Н	2-F-C ₆ H ₄	Н	E	CO ₂ CH ₃	
388	N	NH	CH ₃	Н	2-Cl-C ₆ H ₄	Н	COCH ₃	CO ₂ CH ₃	
389	N	NH	CH ₃	Н	3-CI-C ₆ H ₄	• Н	. Н	CO ₂ CH ₃	
390	N	NH	CH ₃	· H	4-Cl-C ₆ H ₄	Н	Н	CO ₂ CH ₃	
391	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ CI	Н	CH ₃	Н	
392	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ Cl	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	CF ₃	
393	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ CI	Н	Н	CF ₃	
394	N	NH	CH ₃	CH ₃	М	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	CF ₃	
395	N	NH	CH ₃	CH ₃	CH ₂ Cl .	Н	Н	CF ₃	
396	N	NH	CH ₃	Н	CH₂Cl	Н	Н	Н	
397	N	NH	CH ₃	Н	CH ₂ Cl	Н	Н	Е	
398	N	NH	CH ₃	· H	CH₂Cl	Н	E	Н	
399	N	NH	CH ₃	Н	CH₂CI	Н	COCH ₃	Н	
400	N	NH	CH ₃	CH ₃	3,5-diCl-C ₆ H ₃	Н	CO₂CH₃	Н	
401	СН	0	Н	i -C ₃ H ₇	СН₃	Н	Н	Н	油
402	СН	0	Н	n-C ₄ H ₉	CH ₃	Н	Н	Н	117-118
403	СН	Ο.	Н	n-C ₅ H ₁₁	`. CH₃	Н	Н	Н	
404	СН	0	H ·	C ₂ H ₄ -i-Pr	CH ₃	Н	Н	Н	油
405	СН	0	Η٠	n-C ₆ H ₁₃	CH ₃	H ·	Н	H ·	113-115
406	СН	0	Н	Н	n-C₄H ₉	Н	Н	Н	
407	СН	0	н	Н	n-C₅H ₁₁	Н	Н	Н	
408	СН	0	Н	Н	CH(CH ₃) ₂	Н	Н	CH ₃	110-112
409	СН	Ο.	Η٠	n-C ₃ H ₇	n-C ₃ H ₇	Н	Н	Н	112-114
410	N	0	Н	Cl	n-C ₃ H ₇ ·	Н	Ĥ	Н	136-138
411	N	O	Н	Cl	C ₆ H ₅	Н	Н	. н	166-168
412	N ·	0	Н	n-C ₃ H ₇	CH ₃	Ή	н	Н	121-122
413	N	0	Н	n-C ₄ H ₉	CH ₃	Н	Н	Н	100-102
414	N	0	Н	n-C ₆ H ₁₃	CH ₃	Н	н	Н	75-78

_									
415	СН	О	Н	CH₃	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
416	СН	0	Н	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
417	СН	0	Н	C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
418	ĊН	0	Н	i-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
419	СН	0	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₄ H ₉	Н	н	Н	
420	СН	0	H _.	CH ₃	n-C ₅ H ₁₁	Н	н	н	
421	СН	0	Н	C ₂ H ₅	n-C ₅ H ₁₁ -	Н	Н	Н	
422	СН	0	Н	C ₃ H ₇	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
423	СН	0	Н	i-C ₃ H ₇	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
424	СН	0	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₅ H ₁₁	Н	ΪH	Н	1.000
425	СН	0	Н	Н	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Ĥ	
426	СН	0	Н	CH ₃	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	H.	
427	СН	0	Н	C ₂ H ₅	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
428	CH	0	Н	C ₃ H ₇	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	· .
429	СН	0	Н	i-C ₃ H ₇	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
430	СН	0	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	ļН	
.431	N	О	Н	CH ₃	n-C₄H ₉	Н	Н	Н	
432	N	0	Н	C₂H₅	n-C₄H ₉	Н	Н	Н	
433	N	0	Н	C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	Н	·H	Н	
434	N	0	Н	i-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
435	Z	0	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
436	N	0	Н	CH ₃	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
437	Z	0	Н	C ₂ H ₅	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
438	Ŋ	0	Н	C ₃ H ₇	n-C5H11	Н	Н	Н	
439	Z	0	Н	i-C ₃ H ₇	n-C₅H ₁₁	Н	Н	Н	
440	Z	0	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₅ H ₁₁	H	Н	Н	
441	N	0	Н	Н	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
442	N	0	Н	CH ₃	n-C ₆ H ₁₃	H.	Н	Н	
443	N	0	Н	C ₂ H ₅	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
444	N	0	Н	C ₃ H ₇	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	, H	
445	N	· O	Н	i-C₃H₁	n-C ₆ H ₁₃	. Н	Н	Н	
446	N	0	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₆ H ₁₃	H	Н	Н	
447	N.	NH	H	CH ₃	n-C₄H ₉	Н	. Н	Н	
448	Ν	NH	Н	C ₂ H ₅	n-C₄H ₉	Н	Н	Н	

449	N	NH	Н	C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
450	N	NH	Н	i-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	Н	Н.	Н	
451	N	NH	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₄ H ₉	Н	Н	Н	
452	N	NH	Н	CH₃	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
453	N	NH	Н	C ₂ H ₅	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
454	N	NH	Н	C ₃ H ₇	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
455	N	NH	Н	i-C ₃ H ₇	n-C ₅ H ₁₁	Н	. H	Н	
456	N	NH	H	n-C ₄ H ₉	n-C ₅ H ₁₁	Н	Н	Н	
457	». N	NH	Н	Н	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	н	
458	N	NH	Н	CH ₃	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
459	N	NH	Н	C ₂ H ₅	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
460	N	NH	Н	C ₃ H ₇	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
461	N	NH	Н	i-C ₃ H ₇	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	н	
462	N	ΝН	Н	n-C ₄ H ₉	n-C ₆ H ₁₃	Н	Н	Н	
463	СН	0	Н	Н	CH ₂ -Ph-4-Cl	H	Н	Н	
464	СН	0	Н	CH ₃	CH ₂ -Ph-4-Cl	Н	Н.	Н	
465	СН	0	Н	C ₂ H ₅	CH ₂ -Ph-4-Cl	Н	Н	Н	
466	СH	0	Н	CH ₂ -Ph-4-Cl	CH₃	Ĥ	Н	Н	
467	СН	0	Н.	CH ₂ -Ph-4-Cl	C₂H₅	Н	Н.	Н	
468	СН	0	Н	CH ₂ -Ph-4-CI	C ₃ H ₇	Н	Н	Н	
469	СН	0	Н	CH ₃	CF ₃	Н	Н	. Н	
470	СН	0	Н	Cl	CF ₃	Н	Н	Н	
471	СН	0	Н	C ₂ H ₅	CF ₃	H	Н	Н	
472	СН	0	Н	n-C ₃ H ₇	CF ₃	Н	Н	Н	
473	СН	0	Н	n-C ₄ H ₉	CF₃	Н	H .	Н	
474	ĊН	0	Н	Н	CH ₂ CH ₂ -Ph	Н	Н	Н	
475	СН	0	Н	CH₃	-4-CI	Н	Н	Н	
476	СН	0	н	Н	CH₂Bu-t	Н	Н	. Н	
477	СН	0	Н	CH ₃	CH₂Bu-t	Н	Н	н	
478	СН	.0	Н	n-C ₃ H ₇	CH₂Bu-t	Н	. н	Н	
479	СН	0	H ·	CH₂Bu-t	CH ₃	Н	Н	Н .	
480	СН	0	Н	CH ₂ CH ₂ -Ph	CH ₃	Ή	Н	Н	
481	СН	0	Н	-4-Cl	C ₂ H ₅ .	Н	Н	Н	
482	СН	0	н		C ₃ H ₇	Н	н	Н	

483	СН	0	Н	CO₂CH₃	CH ₃	.H	Н	Н	
484	СН	0	Н	CO ₂ CH ₃	CF ₃	Н	Н	Н	
485	СН	0	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Н	Н	Н	
486	СН	. О	Н	CO ₂ C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇	Н	Н	Н	
487	СН	0	Н	CONHCH ₃	CH ₃	н	Н	Н	
488	СН	0	Н	CONHC₂H5	CH ₃	Н	Н	Н	
489	СН	0	Н	CON(CH ₃) ₂	CH ₃	Н	Н	Н	
490	СН	0	Н	CH₃	CO ₂ CH ₃	Н	Н	Н	

* 表中数字表示熔点,单位为 ℃。

本发明还提供了通式(I)所示的苯并吡喃酮类化合物及其立体异构体的制备方法:

由式(II)所示的苄卤和式(III)所示的含羟基的苯并吡喃酮类化合物在碱性条件下通过反应式1所示的步骤来制备。

反应式 1:

5

10

其中: Z是离去基团,如卤素(氯、溴或碘)。

 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、A、B 各基团的定义同上。

通式(I) 化合物的制备条件:在适当的溶剂中,用适当的碱处理通式(III) 所示的 羟基苯并吡喃酮类化合物形成盐,然后加入式(II) 的化合物,在适当的温度下进行反应。 反应完成之后,以常规方法处理即得目的产物。

所说的适当的溶剂可选自如四氢呋喃、乙腈、甲苯、二甲苯、苯、N,N 二甲基甲酰胺、二甲亚砜、丙酮或丁酮等。

所说的适当的碱可选自如氢氧化钾、氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、三乙胺、 15 吡啶或氢化钠等。

所说的适当的温度指室温至溶剂沸点温度,通常为20~100℃。

反应可在 30 分钟至 20 小时内完成,通常 1~10 小时。反应终点可用薄层色谱(TLC)法控制。

通式(II) 所示的化合物可以由已知方法制得,见 USP4723034、USP5554578。

通式(III)所示的羟基苯并吡喃酮类化合物,部分有市售,也可以按照 Journal of Medicinal Chemistry,2001,44(5),664-671 中报道的方法,由 R_5 COCHR $_4$ CO $_2$ CH $_3$ (C_2 H $_5$)与取代的间苯二酚制得,并且可以不经纯化直接用于制备目的产物。合成的通式(III)所示的部分羟基苯并吡喃酮类化合物见表 2:

表 2

~~~						
通式(III)	R ₄	R ₅	R ₆	R ₇	R ₈	物性*
化合物						
III-1	Н	CH ₃	Н	Н	COCH ₃	158-160
III-2	Н	CH ₃	Н	Н	C(=NOMe)CH ₃	129-140
111-3	Н	CH ₃	Н	Н	CO ₂ CH ₃	219-222
111-4	Н	CH ₃	Н	Н	CH ₃	256-258
111-5	CI	CH ₃	Н	Н	Н	230-234
111-6	Н	CF ₃	Н	Н	Н	180-183
111-7	C ₆ H ₅ CH ₂	CH ₃	Н	Н	Н	208-212
111-8	Н	4-F-C ₆ H ₄	Н	Н	Н	256-262
111-9	Н	3,4-(OMe) ₂ C ₆ H ₄	Н	Н	Н	184-188
III-10	F	CH ₃	Н	Н	Н	203-206
III-11	Н	C ₆ H ₅	Н	Н	Н	240-242
III-12	Н	C ₆ H ₅	Н	Н	CH ₃	260-262
III-13	CI	C ₆ H ₅	Н	H.	н .	188-190
III-14	CH ₃	CH ₃	Н	Н	Н	118-120
III-15	CH ₃	CH ₃	Н	Н	CH ₃	218-222
111-16	Cl	n-C ₃ H ₇	Н	Н	СН3	176-178
III-17 ⁻	Cl	n-C ₃ H ₇	Н	Н	Н	148-150
111-18	Н	i-C ₃ H ₇	Н	Н	CH ₃	160-162
III-19	n-C ₆ H ₁₃	CH ₃	Н	Н	Н	170-172
111-20	i-C ₃ H ₇ CH ₂ CH ₂	CH ₃	Н	Н	Н	101-102
111-21	n-C ₄ H ₉	CH ₃	Н	Н	Н	134-136
III-22	n-C ₃ H ₇	СН3	Н	Н	Н	142-144
III-23	Н	CH₂OCH₃	Н	H.	Н	186-190

^{*}表中数字表示熔点,单位为 ℃。

通式(V)和(VII)的化合物可以分别由通式(IV)和(VII)与甲胺水溶液反应而很容易地获得:

A=N, B=O (IV);

15

20

25

30

A=N, B=NH (V);

A=CH, B=O (VI);

A=CH, B=NH (VII).

本发明还提供了一种杀虫杀菌组合物,该组合物中活性组分为通式(I)的化合物;组合物中的活性组分的重量百分含量为0.1-99%,余量为农业上可接受的载体。

本发明还提供了如上所定义的组合物的制备方法:将通式(I)的化合物与载体混合。这种组合物可以含本发明的单一化合物或几种化合物的混合物。

本发明组合物中的载体系满足下述条件的物质:它与活性成分配制后便于施用于待处理的位点,例如可以是植物、种子或土壤;或者有利于贮存、运输或操作。载体可以是固 体或液体,包括通常为气体但已压缩成液体的物质,通常在配制杀虫、杀菌组合物中所用的载体均可使用。

合适的固体载体包括天然和合成的粘土和硅酸盐,例如硅藻土、滑石、硅镁土、硅酸铝(高岭土)、蒙脱石和云母;碳酸钙;硫酸钙;硫酸铵;合成的氧化硅和合成硅酸钙或硅酸铝;元素如碳和硫;天然的或合成的树脂如苯并呋喃树脂,聚氯乙烯和苯乙烯聚合物或共聚物;固体多氯苯酚;沥青;蜡如蜂蜡或石蜡。

合适的液体载体包括水;醇如异丙醇或乙醇;酮如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丙基酮 或环己基酮;醚;芳烃如苯、甲苯、二甲苯;石油馏分如煤油或矿物油;氯代烃如四氯化 碳、全氯乙烯或三氯乙烯。通常,这些液体的混合物也是合适的。

杀虫杀菌组合物通常加工成浓缩物的形式并以此用于运输,在施用之前由使用者将其稀释。少量表面活性剂的存在有助于稀释过程。这样,本发明的组合物中至少有一种载体优选是表面活性剂。例如组合物可含有至少两种载体,其中至少一种是表面活性剂。

表面活性剂可以是乳化剂、分散剂或润湿剂;它可以是非离子的或离子的表面活性剂。合适的表面活性剂的例子包括聚丙烯酸和木质素磺酸的钠盐或钙盐;分子中含至少 12 个碳原子的脂肪酸或脂肪胺或酰胺与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物。甘醇、山梨醇、蔗糖或季戊四醇脂肪酸酯及这些酯与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物;脂肪醇或烷基苯酚如对辛基苯酚或对辛基甲苯酚与环氧乙烷和/或环氧丙烷的缩合物;这些缩合产物的硫酸盐和磺酸盐;在分子中至少含有 10 个碳原子的硫酸或磺酸酯的碱金属或碱土金属盐,优选钠盐,例如硫酸月桂酸酯钠,硫酸仲烷基酯钠,磺化蓖麻油钠盐,磺酸烷基芳基酯钠,如十二烷基苯磺酸钠盐。

本发明的组合物的实例是可湿性粉剂、粉剂、颗粒剂和溶液,可乳化的浓缩剂、乳剂、 悬浮浓缩剂、气雾剂和烟雾剂。可湿性粉剂通常含 25,50 或 75%重量活性成分,且通常

除固体惰性载体之外,还含有 3-10%重量的分散剂,且若需要可加入 0-10%重量的稳定剂和/或其它添加剂如渗透剂或粘着剂。粉剂通常可成型为具有与可湿性粉剂相似的组成但没有分散剂的粉剂浓缩剂,再进一步用固体载体稀释,得到通常含 0.5-10%重量活性组分的组合物。粒剂通常制备成具有 10 至 100 目(1.676-0.152mm)大小,且可用成团或注入技术制备。通常粒剂含 0.5-75%重量的活性成分和 0-10%重量的添加剂如稳定剂、表面活性剂、缓释改良剂。所谓的"可流动干粉"由具有相对高浓度活性成分的相对小的颗粒组成。可乳化浓缩剂除溶剂外,当需要时通常含有共溶剂,1-50%W/V 活性成分,2-20%W/V 乳化剂和 0-20%W/V 其他添加剂如稳定剂、渗透剂和腐蚀抑制剂。悬浮浓缩剂通常含有10-75%重量的活性成分、0.5-15%重量的分散剂、0.1-10%重量的其它添加剂如消泡剂、腐蚀抑制剂、稳定剂、渗透剂和粘着剂。

水分散剂和乳剂,例如通过用水稀释按照本发明的可湿性粉剂或浓缩物得到的组合物,也列入本发明范围。所说的乳剂可具有油包水或水包油两种类型。

通过在组合物中加入其他的一种或多种杀菌剂,使其能比单独的通式(I)化合物具有更广谱的活性。此外,其他杀菌剂可对通式(I)化合物的杀菌活性具有增效作用。也可将通式(I)化合物与其他杀虫剂混用,或同时与另一种杀菌剂以及其他杀虫剂混用。

本发明具有如下优点:

10

15

20

25

30

35

本发明的化合物具有很好的杀虫活性,可用于防治各种作物上害虫。例如可用于防治 粘虫、小菜蛾、蚜虫、朱砂叶螨、二斑叶螨、瓢虫、害螨以及淡色库蚊。尤其对瓢虫和淡 色库蚊有特效,特别适合于对害虫的综合防治。

本发明的化合物同时具有广谱的杀菌活性,可用于防治在各种作物上由卵菌纲、担子菌纲、子囊菌和半知菌类等多种病菌引起的病害,而且由于这些化合物具有很高的生物活性使得在很低的剂量下就可以获得很好的效果。它们具有内吸活性并可用作叶面和土壤杀菌剂,可应用在防治各种作物上的病害,特别适合于防治下列植物病害:葡萄霜霉病、水稻纹枯病、水稻稻瘟病、番茄早疫病、番茄晚疫病、小麦锈病、小麦叶斑病、小麦白粉病、黄瓜有粉病、黄瓜霜霉病、黄瓜灰霉病等。

#### 具体实施方式

以下具体的实例来进一步说明本发明。

合成实施例

实例 1: 化合物 1 的制备方法

在室温下,将 0.84 克 60%的氢化钠加入反应瓶中,用石油醚洗涤后,向其中加入 30 毫升干燥的 N,N 二甲基甲酰胺,搅拌反应半小时,向其中加入 1.7 克 7-羟基香豆素,继续搅拌至无气体放出,加入 3 克(E)-2-[2-(溴甲基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯,继续搅拌 3 小时。将反应混合物倒入冰水中,乙酸乙酯萃取 3 次,合并萃取液,用饱和食盐水洗 3 次,干燥,过滤,减压浓缩,得油状液体 5 克。柱层析得到标题化合物 2.8 克,为浅红黄色油

状物, 收率 76.5%。

10

15

20

25

30

核磁数据(¹HNMR, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃): δ ppm 3.69 (3H, s), 3.88 (3H, s), 5.04 (2H, s), 6.19-6.23 (1H, d), 6.77 (1H, s), 6.83-6.87 (1H, d), 7.18-7.20 (1H, m), 7.26-7.34 (4H, m), 7.48-7.64 (2H, m)。

实例 2: 化合物 2 的制备

在室温下,将 0.45 克 60%的氢化钠加入反应瓶中,用石油醚洗涤后,向其中加入 20 毫升干燥的 N,N 二甲基甲酰胺,搅拌反应半小时,向其中加入 1.0 克 7-羟基-4-甲基香豆素,继续搅拌至无气体放出,加入 1.66 克(*E*)-2-[2-(氯甲基)苯基]-3-甲氧基丙烯酸甲酯,继续搅拌 3 小时。将反应混合物倒入冰水中,乙酸乙酯萃取 3 次,合并萃取液,用饱和食盐水洗 3 次,干燥,过滤,减压浓缩,得黄色固体为粗产品。用乙酸乙酯和石油醚的混合液(1: 2)柱层析得到标题化合物 1.73 克,熔点 140-143°C。收率 80%。

核磁数据( 1 HNMR,300MHz,内标 TMS,溶剂 CDCl₃):  $^{\delta}$  ppm 2.38(3H,s),3.74(3H,s),3.89(3H,s),5.04(2H,s),6.11(1H,s),6.77(1H,s),6.85-6.89(1H,d),7.17-7.20(1H,m),7.32-7.35(2H,m),7.49-7.52(2H,m),7.64(1H,s)。

实例 3: 化合物 101 的制备

在室温下,将含有 1.2 克无水碳酸钾、1.0 克 7-羟基-4-甲基香豆素、1.70 克 2-溴甲基-α-(甲氧亚胺基)苯乙酸甲酯于 20 毫升丁酮的混合液加热回流搅拌反应 5 小时,将反应混合物倒入冰水中,乙酸乙酯萃取 3 次,合并萃取液,饱和食盐水洗 3 次,干燥,过滤,减压浓缩,得黄色固体为粗产品。用乙酸乙酯和石油醚的混合液(1:2)柱层析得到标题化合物 1.77 克,熔点 150-152℃。收率 83%。

核磁数据(¹HNMR, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃): δ ppm 2.39(3H,s), 3.87(3H,s), 4.05(3H,s), 5.02(2H,s), 6.13(1H,s), 6.80-6.86(2H,m), 7.23-7.26(1H,m), 7.43-7.49(4H,m)。 实例 4: 化合物 **153** 的制备

将 0.27 克化合物 **101** 与两倍摩尔比的甲胺在 30 毫升甲醇中室温搅拌过夜,浓缩后用乙酸乙酯萃取 2 次,合并的提取物用水洗涤 3 次,再用饱和食盐水洗 2 次,干燥,过滤,浓缩,得标题化合物 0.24 克,熔点 210-214℃。收率 89%。

核磁数据(¹HNMR, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃): δ ppm 2.38(3H,s), 2.91-2.93(3H,d), 3.97(3H,s), 5.02(2H,s), 6.13(1H,s), 6.82-6.87(3H,m), 7.23(1H,d), 7.39-7.50(4H,m)。

其他化合物参照上述方法合成。

其他部分化合物的核磁数据(¹HNMR, 300MHz, 内标 TMS, 溶剂 CDCl₃)如下: 化合物 3: δ ppm 2.36(3H,s), 2.37(3H,s), 3.72(3H,s), 3.84(3H,s), 5.09(2H,s), 6.13(1H,s), 6.75-6.78(1H,d), 7.18-7.21(1H,m), 7.34-7.36(3H,m), 7.50-7.52(1H,m)7.61(1H,s)。

合物 4: δ ppm 2.41(3H,s), 3.69(3H,s), 3.81(3H,s), 5.08(2H,s), 6.20(1H,s), 6.68-6.71(1H,d), 7.18-7.21(4H,m), 7.32-7.50(5H,m), 7.59(1H,s), 7.92(1H,m)。

化合物 5: δ ppm 2.17(3H,s), 2.35(3H,s), 3.73(3H,s), 3.88(3H,s), 5.02(2H,s), 6.78(1H,s), 6.83-6.85(1H,d), 7.31-7.34(3H,m), 7.45-7.47(2H,d), 7.62(1H,s)。

化合物 6: δ ppm 2.32(3H,s), 2.31-2.36(6H,d), 3.69(3H,s), 3.84(3H,s), 5.07(2H,s), 6.74-6.77(1H,d), 7.17-7.20(1H,m), 7.31-7.36(3H,m), 7.51-7.54(1H,m), 7.61(1H,s)。

化合物 12: δ ppm 2.53(3H,s), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.04(2H,s), 6.78(1H,s), 6.83-6.85(1H,d), 7.18-7.21(1H,m), 7.32-7.35(2H,m), 7.47-7.50(2H,d), 7.64(1H,s)。

5

15

20

25.

化合物 17:  $\delta$  ppm 1.25-1.32(3H,m), 2.36(3H,s), 2.74-2.76(2H,m), 3.71(3H,s), 3.84(3H,s), 5.08(2H,s), 6.15(1H,s), 6.75-6.78(1H,d), 7.18-7.21(1H,m), 7.33-7.38(3H,m), 7.50-7.54(1H,m), 7.61(1H,s)。

10 化合物 18: δ ppm 1.10-1.15(3H,t), 2.37(3H,s), 2.60-2.68(2H,q), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.03(2H,s), 6.76(1H,d), 6.84-6.88(1H,dd), 7.18-7.21(1H,m), 7.32-7.35(2H,m), 7.45-7.53(2H,m), 7.63(1H,s)。

化合物 19: δ ppm 3.48(3H,s), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 4.56(2H,s), 5.04(2H,s), 6.34(1H,s), 6.79(1H,d), 6.84-6.88(1H,dd), 7.18-7.21(1H,m), 7.30-7.36(2H,m), 7.41-7.44(1H,d), 7.48-7.51(1H,m), 7.64(1H,s)。

化合物 24: δ ppm 3.72(3H,s), 3.92(3H,s), 5.10(2H,s), 6.78(1H,s), 6.94-7.21(1H,d), 7.22(1H,m), 7.33-7.35(2H,m), 7.36-7.45(2H,m), 7.66(1H,s), 8.13(1H,s)。

化合物 25: δ ppm 2.36(3H,d), 2.62(3H,d), 3.71(3H,s), 3.84(3H,s), 5.09(2H,s), 6.82(1H,d), 7.19-7.21(1H,m), 7.33-7.35(3H,m), 7.36-7.37(1H,m), 7.61(1H,s)。

化合物 26: δ ppm 1.25-1.30(6H,m), 3.20-3.23(1H,m), 3.74(3H,s), 3.91(3H,s), 5.04(2H,s), 6.15(1H,s), 6.790-6.799(1H,d), 6.80-6.90(1H,m), 7.18-7.23(1H,m), 7.32-7.37(2H,m), 7.48-7.57(2H,m), 7.64(1H,s)。

化合物 27: δ ppm 0.95-1.00(3H,t), 1.58(2H,m), 2.36(3H, s), 2.58(2H,t), 3.73(3H,s), 3.89(3H,s), 5.02(2H,s), 6.75(1H,d), 6.84-6.88(1H,dd), 7.18(1H,m), 7.31-7.34(1H,m), 7.47-7.51(2H,m), 7.63(1H,s)。

化合物 29: δ ppm 3.74(3H,s), 3.90(3H,s), 5.06(2H,s,), 6.17(1H,s), 6.80-6.85(2H,m), 7.24-7.26(1H,m), 7.28-7.35(5H,m), 7.38-7.51(3H,m), 7.66(1H,s)。

化合物 32: δ ppm 3.73(3H,s), 3.90(3H,s), 5.05(2H,s), 6.75-6.78(1H,dd), 6.84-6.85(1H,d), 6.94-6.98(1H,d), 7.19-7.21(1H,m), 7.30-7.35(4H,m), 7.53-7.55(4H,m), 7.65(1H,s)。

化合物 33: δ ppm 1.27-1.32(3H,m), 2.74-2.77(2H,m), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.04(2H,s), 6.13(1H,s), 6.78-6.79(1H,d), 6.85-6.89(1H,m), 7.18-7.21(1H,m), 7.32-7.35(2H,m), 7.48-7.52(2H,m), 7.64(1H,s)。

化合物 34: δ ppm 0.90-1.03(3H,m), 1.67-1.72(2H,m), 2.65-2.70(2H,m), 3.73(3H,s), 3.89(3H,s), 5.04(2H,s), 6.10(1H,s), 6.78-6.79(1H,d), 6.85-6.89(1H,m), 7.19-7.21(1H,m),

7.33-7.35(2H,m), 7.47-7.51(2H,m), 7.64(1H,s).

10

15

20

25

30

35

化合物 35: δ ppm 1.00-1.25(3H,m), 1.69-1.72(2H,m), 2.36(3H,s), 2.65-2.70(2H,m), 3.71(3H,s), 3.84(3H,s), 5.08(2H,s), 6.12(1H,s), 6.75-6.78(1H,d), 7.21-7.26(1H,m), 7.33-7.38(3H,m), 7.50-7.53(1H,m), 7.61(1H,s)。

化合物 36: δ ppm 0.97(3H,t), 1.66(2H,m), 2.67(3H,s), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.04(2H,s), 6.78(1H,d), 6.85-6.88(1H,dd), 7.22(1H,m), 7.33-7.35(2H,m), 7.46-7.49(2H,m), 7.64(1H,s)。

化合物 37: δ ppm 1.05(3H,m), 1.57-1.64(2H,m), 2.16(3H,s), 2.71-2.76(2H,t), 3.70(3H,s), 3.83(3H,s), 5.02(2H,s), 6.78(1H,d), 6.87(1H,m), 7.20(1H,m), 7.32(2H,m), 7.45(2H,m), 7.64(1H,s)。

化合物 38: δ ppm(DMSO-d₆) 3.65(3H,s), 3.88(3H,s), 5.03(2H,s), 6.15(1H,s), 6.83-6.87(1H,dd), 6.91(1H,d), 7.09-7.17(2H,m), 7.23-7.35(4H,m), 7.43-7.46(1H,m), 7.51-7.55(2H,m), 7.66(1H,s)。

化合物 41: δ ppm 3.74(3H,s), 3.91(3H,s), 5.06(2H,s), 6.20(1H,s), 6.86(2H,m), 7.22(2H,m), 7.33-7.36(2H,m), 7.56(3H,m), 7.66(1H,s), 7.77(2H,d)。

化合物 50: δ ppm 2.34(3H,s), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.04(2H,s), 6.78-6.79(1H,d), 6.92-6.96(1H,dd), 7.18-7.21(1H,m), 7.32-7.35(2H,m), 7.41-7.44(1H,d), 7.48-7.51(1H,m), 7.65(1H,s)。

化合物 52: δ ppm 3.74(3H,s), 3.90(3H,s), 5.06(2H,s), 6.20(1H,s), 6.80-6.86(1H,m), 7.18-7.22(1H,m), 7.32-7.37(4H,m), 7.41-7.44(2H,m), 7.50-7.52(4H,m), 7.65(1H,s)。

化合物 58:  $\delta$  ppm 3.74(3H,s), 3.91(6H,d), 3.96(3H,s), 5.06(2H,s), 6.19(1H,s), 6.81-6.82(1H,m), 6.85(1H,s), 6.93-7.04(3H,m), 7.19-7.22(1H,m), 7.33-7.36(2H,m), 7.44-7.52(2H,m), 7.66(1H,s)。

化合物 68: δ ppm(DMSO-d₆) 2.49(3H,s), 3.66(3H,s), 3.89(3H,s), 3.92(2H,s), 5.00(2H,s), 6.78-6.79(1H,d), 6.85-6.89(1H,dd), 7.10-7.22(6H,m), 7.26-7.29(2H,m), 7.42(1H,m), 7.61-7.66(2H,m)。

化合物 100: δ ppm 2.54(3H,s), 3.87(3H,s), 4.04(3H,s), 5.02(2H,s), 6.81-6.85(1H,s), 7.26(1H,d), 7.43-7.52(5H,m)。

化合物 102: δ ppm 2.32(3H,s), 2.37(3H,s), 3.84(3H,s), 4.03(3H,s), 5.05(2H,s), 6.13(1H,s), 6.76-6.79(1H,d), 7.26(1H,d), 7.34-7.43(3H,m), 7.45-7.46(1H,d)。

化合物 103: δ ppm 2.18(3H,s), 2.37(3H,s), 3.91(3H,s), 3.98(3H,s), 5.35(2H,s), 6.85(1H,s), 6.86-6.88(1H,d), 7.26-7.40(3H,m), 7.49-7.52(1H,d), 7.62-7.65(1H,d)。

化合物 104: δ ppm 2.17(3H,s), 2.35(3H,s), 3.86(3H,s), 4.04(3H,s), 5.00(2H,s), 6.78-6.85(2H,m), 7.20-7.25(1H,d), 7.40-7.61(4H,m)。

化合物 109: δ ppm 2.91-2.93(3H,d), 3.97(3H,s), 5.02(2H,s), 6.23-6.26(1H,d),

6.82-6.86(3H,m), 7.20-7.23(1H,m), 7.34-7.37(1H,d), 7.39-7.45(2H,m), 7.50-7.53(1H,m), 7.61-7.64(1H,d)。

化合物 111: δ ppm 3.87(3H,s), 4.05(3H,s), 5.02(2H,s), 6.23-6.26(1H,d), 6.79-6.85(2H,m), 7.21(1H,d), 7.34-7.37(1H,d), 7.41-7.45(2H,m), 7.47-7.53(1H,m), 7.61-7.64(1H,d)。

化合物 401: δ ppm 1.32-1.36(6H,m), 2.39(3H,s), 3.27(1H,m), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.03(2H,s), 6.72-6.73(1H,d), 6.83-6.87(1H,dd), 7.17-7.20(1H,m), 7.31-7.34(2H,m), 7.46-7.52(2H,m), 7.63(1H,s)。

化合物 402: δ ppm 0.93(3H,m), 1.45(4H,m), 2.35(3H,s), 2.60(2H,t), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.04(2H,s), 6.78(1H,d), 6.84-6.85(1H,m), 7.18-7.20(1H,m), 7.30-7.35(2H,m), 7.45-7.50(2H,d), 7.64(1H,s)。

化合物 404: δ ppm 1.25(6H,m), 1.39(2H,m), 1.63(1H,m), 2.39(3H,s), 2.62(2H,t), 3.72(3H,s), 3.86(3H,s), 5.01(2H,s), 6.78(1H,d), 6.84(1H,m), 7.20(1H,m), 7.32(2H,m), 7.45(2H,d), 7.64(1H,s)。

15 化合物 405: δ ppm 0.88(3H,t), 1.42-1.52(8H,m), 2.38(3H,s), 2.64(2H,t), 3.72(3H,s), 3.86(3H,s), 5.01(2H,s), 6.78(1H,d), 6.84(1H,m), 7.20(1H,m), 7.32(2H,m), 7.45(2H,d), 7.64(1H,s)。

化合物 408: δ ppm 2.37(3H,s), 3.2-3.6(1H,m), 3.72(3H,s), 3.85(3H,s), 5.09(2H,s), 6.18(1H,s), 6.76-6.79(1H,d), 7.18-7.21(1H,m), 7.34-7.43(3H,m), 7.51-7.54(1H,m), 7.68(1H,5)。 化合物 409: δ ppm 0.96-1.03(6H,m), 1.58-1.63(4H,m), 2.71-2.79(4H,m), 3.72(3H,s), 3.85(3H,s), 5.00(2H,s), 6.79(1H,d), 6.87(1H,m), 7.19(1H,m), 7.32(2H,m), 7.45(2H,m), 7.64(1H,s)。

化合物 410: δ ppm 0.86-0.88(3H,m), 1.68-1.75(2H,m), 2.66-2.71(2H,m), 3.87(3H,s), 4.05(3H,s), 5.02(2H,s), 6.80-6.92(3H,m), 7.21-7.26(1H,d), 7.39-7.69(3H,m)。

化合物 411: δ ppm 3.87(3H,s), 4.05(3H,s), 5.02(2H,s), 6.73-6.77(1H,m), 6.87-6.88(1H,d), 6.97-7.00(1H,d), 7.21-7.24(1H,m), 7.28-7.32(2H,m), 7.42-7.57(6H,m)。 化合物 412: δ ppm 0.94(3H,t), 1.46(2H,m), 2.35(3H,s), 2.60(2H,t), 3.74(3H,s), 3.89(3H,s), 5.04(2H,s), 6.78(1H,d), 6.84(1H,m), 7.20(1H,m), 7.32(2H,m), 7.42-7.45(2H,d), 7.64(1H,s)。

化合物 413: δ ppm 0.94(3H,m), 1.45(4H,m), 2.36(3H,s), 2.60(2H,t), 3.86(3H,s), 4.05(3H,s), 5.00(2H,s), 6.78(1H,d), 6.84(1H,m), 7.20(1H,m), 7.38-7.45(4H,m)。

化合物 414: δ ppm 0.88(3H,m), 1.48-1.65(8H,m), 2.36(3H,s), 2.62(2H,t), 3.86(3H,s), 4.05(3H,s), 5.00(2H,s), 6.85(1H,m), 6.84(1H,m), 7.20(1H,m), 7.39-7.45(4H,m)。

制剂实施例(配方中各组分均为重量百分含量)

实例 5 60%可湿性粉剂

5

10

20

25

30

35

化合物 6 60%

十二烷基萘磺酸钠 2%

木质素磺酸钠 9%

高岭土 补足至 100%

5 各组分(均为固体)混合在一起,在粉碎机中粉碎,直到颗粒达到标准。

实例 6 35% 乳油

化合物 1 35%

亚磷酸 10%

乙氧基化甘油三酸酯 15%

10 环已酮 补足至 100%

亚磷酸溶解在环已酮中,然后加入化合物 1 和乙氧基化甘油三酸酯,得到透明的溶液。

实例 7 30% 水悬浮剂

化合物 25 30%

十二烷基萘磺酸钠 4%

15 半纤维素 2%

环氧丙烷 8%

水 补足至 100%

将化合物 25 与 80%的应加入水量以及十二烷基萘磺酸钠在球磨机中(1mm 珠)中一起粉碎。其它组分溶解在其余的水中,然后搅拌加入其它组分。

20 实例 8 25% 悬浮乳剂

化合物 12 25%

十二烷基醇聚乙二醇磷酸酯(乳化剂1) 4%

乙氧基甘油三酸酯(乳化剂2) 2%

十二烷基苯磺酸钙(乳化剂3) 1.5%

25 环氧甲乙烷环氧丙烷共聚物(分散剂) 2.5%

环己酮(溶剂1) 30%

烷基芳基馏分(沸点>200℃)(溶剂2) 补足至100%

化合物 12 溶解在 80%应加入的溶剂量中,再加入乳化剂和分散剂,将混合物彻底搅拌。混合物在球磨机(1mm 珠)中粉碎,然后加入其余的溶剂。

#### 30 生物活性测定

35

#### 实例 9 杀菌活性测定

用本发明化合物对植物的各种菌病害进行了试验。试验的程序如下:

将植物试材进行盆栽。待测化合物原药用少量 N,N-二甲基甲酰胺溶解,用水稀释至所需的浓度。喷雾施药到植物试材上,24 小时后进行病害接种。接种后,将植物放在恒温恒湿培养箱中,使感染继续,待对照充分发病后(通常为一周时间)进行评估调查。

部分测试结果如下:

5

10

15

25

30

200ppm 时,对黄瓜霜霉病防效为 100%的有化合物 1, 2, 4, 5, 6, 12, 18, 19, 25, 26, 33, 34, 35, 37, 50, 52, 58, 69, 109, 402, 405, 409, 410, 413, 414 等; 防效大于 95%的有化合物 3, 24, 36, 38, 153, 411 等。

200ppm 时,对黄瓜灰霉病防效为 100%的有化合物 2, 6, 18, 50, 58, 100, 402 等; 防效大于 75%的有化合物 6, 101, 102, 103, 106, 412 等。

200ppm 时,对葡萄霜霉病防效为 100%的有化合物 6,7,10 等;防效大于 85%的有化合物 8,106,154 等。

200ppm 时,对水稻纹枯病防效大于 85%的有化合物 3, 101 等。

200ppm 时,对水稻稻瘟病防效大于85%的有化合物6,8,10等。

200ppm 时,对小麦白粉病防效为 100%有化合物 402, 412, 413,等;大于 70%的有化合物 9, 101, 111, 410 等。

200ppm 时,对小麦锈病病防效为 100%的有化合物 6 等; 防效大于 95%的有化合物 7, 10 等; 防效大于 75%的有化合物 8, 154 等。

200ppm 时,对小麦叶斑病防效大于90%的有化合物6等;防效大于80%的有化合物7,8,9,10,11,154等。

200ppm 时,对番茄早疫病防效为 100%的有化合物 6,7等;防效大于 90%的有化合物 8,10等;防效大于 75%的有化合物 11等。

200ppm 时,对番茄晚疫病防效大于 95%的有化合物 6 等,防效大于 75%的有化合物 20 10 等。

200ppm 时,对玉米小斑病防效大于95%的有化合物5,6等。

部分化合物与文献 JP04-182461 报道化合物 JP51 防治黄瓜霜霉病活性比较结果见表 3。

10.5	PJ 1	H 54.74			-11-12	MASIN (	Johh	111 /					
化合物	1	2	5	6	12	26	37	52	402	405	409	.414	JP51
防效(%)	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	20

表 3 防治黄瓜霜霉病活性比较试验 (50ppm)

#### 实例 10 杀虫杀螨活性测定

取一定数量的三龄幼虫放入饲养盆中,以经过药物处理的玉米叶饲养。施药方法为波特喷雾。喷药量为 1mL,喷雾压力为 13.5 磅/平方英寸。

调查及结果统计:

药液浓度为 10ppm 时, 化合物 2、5、6 等对供试靶标淡色库蚊死亡率达 100%。

药液浓度为 600ppm 时, 化合物 5、6 还对粘虫、小菜蛾、桃蚜的也显示相当的活性, 大于 50%。

药液浓度为 300ppm 时, 化合物 7、9、10 对供试靶标墨西哥飘虫死亡率达 100%; 化合物 7 还对二斑叶螨显示相当的活性, 大于 50%。

## 权利要求书

1、一种苯并吡喃酮类化合物,如通式(I)所示:

5 式中:

A 选自 CH 或 N;

B 选自 O、S 或 NR₉, R₉选自氢或 C₁—C₁₂烷基;

 $R_1$ 、 $R_2$ 分别选自氢、 $C_1$ — $C_{12}$ 烷基或卤代  $C_1$ — $C_{12}$ 烷基;

 $R_3$ 选自氢、 $C_1$ — $C_{12}$ 烷基、卤代  $C_1$ — $C_{12}$ 烷基或  $C_1$ — $C_{12}$ 烷氧基:

10 R₄、R₅、R₆、R₇、R₈可相同或不同,分别选自氢、卤素、氰基、硝基、C₁—C₁₂ 烷基、C₂—C₁₂ 烷基、C₁—C₁₂ 烷基、C₁—C₁₂ 烷基、C₁—C₁₂ 烷基基、C₁—C₁₂ 烷硫基、C₁—C₁₂ 烷硫基、C₁—C₁₂ 烷硫基、C₁—C₁₂ 烷元基羰基、C₁—C₁₂ 烷氧基羰基、C₁—C₁₂ 烷氧基羰基、C₁—C₁₂ 烷氧基羰基。C₁—C₁₂ 烷氧基羰基。C₁—C₁₂ 烷基或含有 0-2 个 C₁—C₁₂ 烷基取代的胺基 C₁—C₁₂ 烷基、含有 0-3 个取代基的芳基、芳氧基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基、芬基 C₁—C₁₂ 烷基、芳基 C₁—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷氧基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷氧基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷氧基。2 元—C₁₂ 烷基或杂芳基。2 元—C₁₂ 烷氧基。2 元—C₁₂ 烷基。2 元—C₁₂ 烷氧基。2 元—C₁₂ 烷基。2 元—C₁₂



其中:  $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 分别选自氢、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、芳基或芳基  $C_1$ - $C_{12}$ 烷基; 当  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、20  $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 均为氢时,B 不为  $NR_9$ ;

及其立体异构体。

25

2、根据权利要求1所述的化合物,其特征在于:通式(I)中A选自CH或N;

B 选自 O、S 或 NR₉, R₉选自氢或  $C_1$ — $C_6$  烷基;

 $R_1$ 、 $R_2$  分别选自氢、 $C_1$ — $C_6$  烷基或卤代  $C_1$ — $C_6$  烷基;

 $R_3$  选自氢、 $C_1$ — $C_6$  烷基、卤代  $C_1$ — $C_6$  烷基或  $C_1$ — $C_6$  烷氧基;

 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 可相同或不同,分别选自氢、卤素、氰基、硝基、 $C_1$ — $C_6$  烷基、 $C_2$ — $C_6$  烷基、 $C_1$ — $C_6$  烷基、 $C_1$ — $C_6$  烷氧基、 $C_1$ — $C_6$  烷氧基、 $C_1$ — $C_6$  烷氧基以及  $C_1$ — $C_6$  烷氧

基羰基  $C_1$ — $C_6$ 烷基、 $C_1$ — $C_6$  卤代烷氧基  $C_1$ — $C_6$ 烷基或含有 0-2 个  $C_1$ — $C_{12}$ 烷基取代的胺 基 C₁—C₆烷基, 含有 0-3 个取代基的芳基、芳氧基、芳基 C₁—C₆烷基、芳基 C₁—C₆烷氧 基、芳氧基 C1-C6烷基、芳基 C1-C6烷氧 C1-C6烷基、杂芳基、杂芳基 C1-C6烷基、 杂芳基 C1-C6 烷氧基, 其所述 0-3 个取代基可以选自卤素、硝基、C1-C2 烷基、C1-C2 卤代烷基、 $C_1$ — $C_2$ 烷氧基或  $C_1$ — $C_2$ 烷氧基  $C_1$ — $C_2$ 烷基,以及如下通式表示的基团:

其中:  $R_{10}$ 、 $R_{11}$  分别选自氢、 $C_1$ — $C_{12}$  烷基、芳基或芳基  $C_1$ — $C_6$  烷基; 当  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 R₆、R₇、R₈均为氢时,B不为NR₉。

3、根据权利要求 2 所述的化合物, 其特征在于: 通式 (I) 中

A 选自 CH 或 N; 10

15

25

B选自O或NH:

R₁、R₂分别选自甲基;

R3 选自氢或甲基;

 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 可相同或不同,分别选自氢、卤素、氰基、硝基、 $C_1$ — $C_6$ 烷基、  $C_2$ 一 $C_6$ 烯基、 $C_1$ 一 $C_6$  卤代烷基、 $C_1$ 一 $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ — $C_6$ 烷氧基  $C_1$ — $C_6$ 烷氧基  $C_1$ — $C_6$ 烷基、 $C_1$ — $C_6$  烷氧基羰基、 $C_1$ — $C_6$  烷氧基羰基  $C_1$ — $C_3$  烷基、 $C_1$ — $C_3$  卤代烷氧基  $C_1$ — $C_3$ 烷基或 0-2 个  $C_1$ — $C_3$  烷基取代的胺基  $C_1$ — $C_3$  烷基,可以被 0-2 个卤素、硝基、 $C_1$ — $C_5$  烷 基、 $C_1-C_2$  卤代烷基、 $C_1-C_2$  烷氧基或  $C_1-C_2$  烷氧基  $C_1-C_2$  烷基取代的苯基、苯氧基、 苯基 C₁—C₂ 烷基、苯基 C₁—C₂ 烷氧基、苯氧基 C₁—C₂ 烷基、苄基、苄氧基或苄氧基 C₁ 20 —C, 烷基, 以及如下通式表示的基团:



其中:  $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 分别选自氢或  $C_1$ — $C_6$ 烷基; 当  $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 均为氢时, B不为 NH。

4、根据权利要求 3 所述的化合物, 其特征在于: 通式(I)中

A选自CH或N;

B选自O或NH;

R₁、R₂选自甲基;

R3 选自氢或甲基;

R4、R5、R6、R7、R8可相同或不同,分别选自氢、氯、溴、氟、氰基、C1—C6烷基、  $C_1$ 一 $C_6$  卤代烷基、 $C_1$ 一 $C_6$  烷基羰基、 $C_1$ 一 $C_6$  烷氧基、 $C_1$ — $C_6$  烷氧基  $C_1$ — $C_3$  烷基、 $C_1$ — $C_3$ 30 卤代烷氧基  $C_1$ — $C_3$  烷基、0-2 个  $C_1$ — $C_3$  烷基取代的胺基  $C_1$ — $C_3$  烷基,可以被 0-2 个卤素、 硝基、 $C_1 - C_2$  烷基、 $C_1 - C_2$  卤代烷基、 $C_1 - C_2$  烷氧基或  $C_1 - C_2$  烷氧基  $C_1 - C_2$  烷基取代的 苯基、苯氧基、苄基、苄氧基,以及如下通式表示的基团:

其中 R₁₀、R₁₁ 为甲基; 当 R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈ 均为氢时, B 不为 NH。

5、一种苯并吡喃酮类化合物的制备方法,其特征在于:通式(I)的化合物由式(II)所示的苄卤和式(III)所示的含羟基的苯并吡喃酮类化合物在碱性条件下反应制得:

$$Z$$
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{9}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{9}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{9}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{9}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{9}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{9}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{1}$ 
 $R_{2}$ 
 $R_{3}$ 
 $R_{4}$ 
 $R_{5}$ 
 $R_{6}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{7}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{8}$ 
 $R_{9}$ 
 $R_{9}$ 

其中:

Z是离去基团,选自氯或溴;

A选自CH或N:

B 选自 O、S 或 NR₉, R₉选自氢或 C₁—C₁₂烷基;

 $R_1$ 、 $R_2$  分别选自氢、 $C_1-C_{12}$ 烷基或卤代  $C_1-C_{12}$ 烷基;

 $R_3$  选自氢、 $C_1$ — $C_{12}$  烷基、卤代  $C_1$ — $C_{12}$  烷基或  $C_1$ — $C_{12}$  烷氧基;

 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$  可相同或不同,分别选自氢、卤素、氰基、硝基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷基、 $C_2$ — $C_{12}$  烯基、 $C_2$ — $C_{12}$  炔基、 $C_1$ — $C_{12}$  卤代烷基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷氧基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷硫基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷硫基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷氧基羰基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷氧基羰基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷氧基羰基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷氧基羰基、 $C_1$ — $C_{12}$  烷氧基羰基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基或含有 0-2 个  $C_1$ — $C_{12}$  烷基取代的胺基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基,含有 0-3 个取代基的芳基、芳氧基、芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基、芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基、芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基、芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基、芬基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基或杂芳基、杂芳基、杂芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基或杂芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基或杂芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基或杂芳基。 $C_1$ — $C_1$  烷基或杂芳基。 $C_1$ — $C_2$  烷基基或杂芳基。 $C_1$ — $C_2$  烷基基或杂

20

10

其中:  $R_{10}$ 、 $R_{11}$  分别选自氢、 $C_1$ — $C_{12}$  烷基、芳基或芳基  $C_1$ — $C_{12}$  烷基: 当  $R_3$ 、 $R_4$ 、  $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 均为氢时,B 不为  $NR_9$ 。

- 6、一种根据权利要求1所述的苯并吡喃酮类化合物在防治作物上害虫的应用。
- 7、一种根据权利要求1所述的苯并吡喃酮类化合物在防治作物上病菌的应用。
- 25 8、一种杀虫杀菌组合物,其特征在于:活性组分为权利要求 1 所述的苯并吡喃酮类化合物;组合物中的活性组分的重量百分含量为 0.1-99%。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/CN2004/001255

		<u> </u>	
A. CLASSI	IFICATION OF SUBJECT MATTER		
A dim o + -		8 A01N43/16	
	o International Patent Classification (IPC) or to both r	national classification and IPC	
B. FIELD	OS SEARCHED	·	
Minimum do	ocumentation searched (classification system followed	d by classification symbols)	
	IPC7 C	07D A61N	-
Documentati	on searched other than minimum documentation to the	ne extent that such documents are included	in the fields searched
Electronic da	ata base consulted during the international search (nar	ne of data base and, where practicable, sear	ch terms used)
	EPODOC, WPI, PAJ	, CPRS, CNKI,CA ,STN	
C. DOCUM	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where a	ppropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
х	JP 2897789 B (SHIONOGI & CO LTD)		1-5, 7-8
	31.May 1999 (31-05-1999)		
	P4, P14 compound 51 and P16 US 4372970 A (HADLER M R et al)		0.
A	8.Feb 1983 (08-02-1983)		1-8
	Full documents		
A	WO 198288 A1 (BAYER AG et al) 27.Dec 2001 (27-12-2001)	·	1-8
	Full documents		
☐ Further	documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.	
* Specia	al categories of cited documents:	"T" later document published after the	
	ent defining the general state of the art which is not	or priority date and not in conflict cited to understand the principle of	
	ered to be of particular relevance	invention	i meory undertying me
	application or patent but published on or after the tional filing date	"X" document of particular relevance;	
	ent which may throw doubts on priority claim (S) or	cannot be considered novel or cannot an inventive step when the docume	
	is cited to establish the publication date of another or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance;	
	ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or	cannot be considered to involve an	inventive step when the
other m	_	document is combined with one or documents, such combination bein	
	ent published prior to the international filing date	skilled in the art	G
Dut late	er than the priority date claimed	"&" document member of the same pa	tent family
Date of the ac	ctual completion of the international search	Date of mailing of the international searce	
	04.Feb 2005 (04.02.2005)	03 1117 0005 1119 .	0 3 · 2 0 0 5)
	ling address of the ISA/CN ucheng Rd., Jimen Bridge, Haidian District,	Authorized officer	本
	100088, Beijing, China	LI Yalin	7.10
racsimile No. 8	86-10-62019451	Telephone No. 86-10-62085610	

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT Information on patent family members

International application No. PCT/CN2004/001255

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 2897789 B	31-05-1999		
US 4372970 A	08-02-1983	EP 0029360 A	27-05-1981
•		WO 8101408 A	28-05-1981
		DK 8103046 A	28-12-1981
		JP 57500147 T	28-01-1982
	• 4,	BR 8009055 A	09-03-1982
WO 0198288 A1	27-12-2001	US 2004102516 A1	27-05-2004
		DE 10030094 A1	20-12-2001
		AU 200170560 A	02-01-2002
	,	EP 1303505 A1	23-04-2003
		BR 200112063 A	13-05-2003
		KR 2003031494 A	21-04-2003
		CN 1443181 A	17-09-2003
		JP 2004501144 Т	15-01-2004

国际申请号

PCT/CN2004/001255

A. 主题的分类

C07D311/08 A01N43/16

按照国际专利分类表(IPC)或者同时按照国家分类和 IPC 两种分类

B. 检索领域

检索的最低限度文献(标明分类系统和分类号)

IPC7 C07D A61N

包含在检索领域中的除最低限度文献以外的检索文献

在国际检索时查阅的电子数据库(数据库的名称,和使用的检索词(如使用))

EPODOC, WPI, PAJ, CPRS, CNKI,CA,STN

#### C. 相关文件

C. 10 A A 1		
类 型*	引用文件,必要时,指明相关段落	相关的权利要求
X	JP 2897789 B (SHIONOGI & CO LTD)	1-5, 7-8
	31.5 月 1999 (31-05-1999)	
	第 4 页反应式 A、第 14 页化合物 51 和第 16 页	
A	US 4372970 A (HADLER M R et al)	1-8
	8.2 月 1983 (08-02-1983)	
	全文	
A	WO 0198288 A1 (BAYER AG et al)	1-8
	27.12 月 2001 (27-12-2001)	
	全文	·

□ 其余文件在	C栏的续页中列出。
---------	-----------

☑ 见同族专利附件。

- * 引用文件的具体类型:
- "A"认为不特别相关的表示了现有技术一般状态的文件
- "E"在国际申请日的当天或之后公布的在先申请或专利
- "L"可能对优先权要求构成怀疑的文件,为确定另一篇 引用文件的公布日而引用的或者因其他特殊理由而引 用的文件
- "O" 涉及口头公开、使用、展览或其他方式公开的文件
- "P"公布日先于国际申请日但迟于所要求的优先权日的文件
- "T" 在申请目或优先权日之后公布,与申请不相抵触,但为了 理解发明之理论或原理的在后文件
- "X" 特别相关的文件,单独考虑该文件,认定要求保护的 发明不是新颖的或不具有创造性
- "Y"特别相关的文件,当该文件与另一篇或者多篇该类文件 结合并且这种结合对于本领域技术人员为显而易见时, 要求保护的发明不具有创造性
- "&" 同族专利的文件

受权官员

国际检索实际完成的日期

04.2 月 2005 (04.02.2005)

国际检索报告邮寄日期

03·3月2005 (03·13·2005)

中华人民共和国国家知识产权局(ISA/CN)

中国北京市海淀区蓟门桥西土城路 6 号 100088 传真号:

电话号码: (86-10)62085610

PCT/ISA/210 表(第 2 页)(2004 年 1 月)

(86-10)62019451

## 国际检索报告 关于同族专利的信息

国际申请号 PCT/CN2004/001255

9

检索报告中引用的 专利文件	公布日期	同族专利	公布日期
JP 2897789 B	31-05-1999		
US 4372970 A	08-02-1983	EP 0029360 A	27-05-1981
	•	WO 8101408 A	28-05-1981
•		DK 8103046 A	28-12-1981
		JP 57500147 T	28-01-1982
		BR 8009055 A	09-03-1982
WO 0198288 A1	27-12-2001	US 2004102516 A1	27-05-2004
·		DE 10030094 A1	20-12-2001
		AU 200170560 A	02-01-2002
	•	EP 1303505 A1	23-04-2003
		BR 200112063 A	13-05-2003
		KR 2003031494 A	21-04-2003
		CN 1443181 A	17-09-2003
		JP 2004501144 T	15-01-2004